## **BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND**



## Prioritätsbescheinigung DE 197 01 446.1 über die Einreichung einer Patentanmeldung

Aktenzeichen:

197 01 446.1

Anmeldetag:

17. Januar 1997

Anmelder/Inhaber:

BASF AG, 67063 Ludwigshafen/DE

Bezeichnung:

3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate

IPC:

C 07 D 413/10, C 07 D 417/20, C 077 D 403/00,

C 07 D 498/10, A 01 N 43/56, A 01 N 43/74,

A 01 N 43/90

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der am 17. Januar 1997 eingereichten Unterlagen dieser Patentanmeldung, hinterlegt mit dem Prioritätsbeleg vom 10. November 1997 bei der Europäischen Patentamt.

München, den 28. April 2010

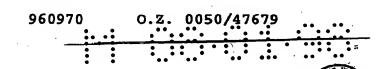
Deutsches Patent- und Markenamt

Die Präsidentin

Im Auftrag



Riester



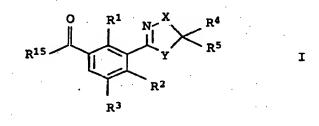
3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate

Zusammenfassung ·

5

Die Erfindung betrifft Benzoylderivate der Formel I





15

in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, 20 Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkylsulfinyl, Halogenalkylsulfinyl, Alkylsulfonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyl;

R<sup>3</sup> Wasserstoff, Halogen oder Alkyl;

25

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Dialkylamino, Phenyl oder Carbonyl, wobei die 6 letztgenannten Reste substituiert sein können;

30 X

O, S, NR9, CO oder CR10R11;

Y

0, S, NR<sup>12</sup>, CO oder CR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>;

R15

35

gegebenenfalls substituiertes in 4-Stellung verknüpftes Pyrazol, das in 5-Stellung einen Hydroxy- oder Sulfonyl-

oxy-Rest tragt;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze; Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung der 3-Heterocyclyl-substituier-40 ten Benzoylderivate; Mittel welche diese enthalten; sowie die Verwendung dieser Derivate oder diese enthaltenden Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen.

960970. O.Z. 0050/47679 .....

3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I

10

15

in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

20 R1, R2

R3

Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylsulfonyl;

25

30

Wasserstoff, Halogen oder C1-C6-Alkyl;

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl,
Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl,
[2,2-Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-hydrazino-l]-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl,
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyliminooxy-C<sub>4</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl-

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyliminooxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogen-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Cyanoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy,

35 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy,

 $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio, Di- $(C_1$ - $C_4$ -alkyl)-amino,  $COR^6$ , Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis

drei\_der folgenden <u>Gruppen tragen können:</u>
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C1-C4-Halogenalkoxy;

oder

•	BA	ASF Akt	iengesellschaft	960970	0,2.0050/47679	
	R4	und R <sup>5</sup>	bis vierfach durc und/oder durch Sa	h C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl su uerstoff oder ei	diyl-Kette, die ein- bstituiert sein kann nen gegebenenfalls toff unterbrochen seir	>k 1
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	5		kann;	<del> </del>		
	odo	er				
	10 R4	und R5	bilden gemeinsam m Carbonyl- oder ein		gen Kohlenstoff eine ruppe;	:
4	R <sup>6</sup>		C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkoxy-C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> -Alkenyloxy,	alkoxy, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -H	alogenalkoxy,	
130	15 R <sup>7</sup>		Wasserstoff oder C	1-C4-Alkyl;		
	R <sup>8</sup>		C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl;		•	
	20 X		O, S, NR <sup>9</sup> , CO oder	CR <sup>10</sup> R <sup>11</sup> ;		
	<b>Y</b>		O, S, NR <sup>12</sup> , CO ode:	CR13R14;	*	
	R <sup>9</sup> , 25	R12	Wasserstoff oder C	1-C4-Alkyl;		•
	R10	, R <sup>11</sup> ,			C <sub>1</sub> ·C <sub>4</sub> ·Halogenalkyl, halkoxycarbonyl oder	
	30 ode	r		÷		
	R <sup>4</sup> 1		gemeinsam eine C <sub>2</sub> -C vierfach durch C <sub>1</sub> -C	6-Alkandiyl-Ket 4-Alkyl substitu	uiert sein kann und/	
			oder durch Sauersto C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl substit kann;		off unterbrochen sein	
	R <sup>15</sup>		ein in 4-Stellung v	erknüpftes Pyra	zol der Formel II	
			R18			
	45		N O I I R16 Z		<u>II</u>	

BASF Aktiengesellschaft 3 wobei R16 C1-C6-Alkyl; 5  $\mathbf{z}$ H oder SO<sub>2</sub>R<sup>17</sup>; R17 C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, Phenyl oder Phenyl, das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder eine bis drei der folgenden 10 Gruppen trägt: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy; R18 Wasserstoff oder C1-C6-Alkyl 15

bedeuten;

wobei X und Y nicht gleichzeitig für Sauerstoff oder Schwefel stehen;

20

und

mit Ausnahme von 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4methylsulfonyl-benzoyl]-1-ethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol,

25 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(5-cyano-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)4-methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol, 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydrothiazol-2-yl)-4methylsulfonyl-benzoyl]-1,3-dimethyl-5-hydroxy-1H-pyrazol und

30 4-[2-Chlor-3-(thiazolin-4,5-dion-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoy1]-1,3-dimethy1-5-hydroxy-1H-pyrazol;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

- 35 Außerdem hetrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, Mittel welche diese enthalten sowie die Verwendung dieser Derivate oder diese enthaltende Mittel zur Schadpflanzenbekämpfung.
- 40 Aus der Literatur, beispielsweise aus WO 96/26206 sind Pyrazol-4-yl-benzoylderivate bekannt.

Die herbiziden Eigenschaften der bisher bekannten Verbindungen sowie die Verträglichkeiten gegenüber Kulturpflanzen können je-45 doch nur bedingt befriedigen. Es lag daher dieser Erfindung die



960970

O.Z. 0050/47679

Aufgabe zugrunde, neue, insbesondere herbizid wirksame, Verbindungen mit verbesserten Eigenschaften zu finden.

Demgemåß wurden die 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate 5 der Formel I sowie deren herbizide Wirkung gefunden.

Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, die die Verbindungen I enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Außerdem wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfahren zur 10 Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit den Verbindungen I gefunden.



Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren enthalten und liegen dann als 15 Enantiomeren oder Diastereomerengemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomeren oder Diastereomeren als auch deren Gemische.

Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirt20 schaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es auf die Art des
Salzes in der Regel nicht ankommt. Im allgemeinen kommen die
Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen
Säuren in Betracht, deren Kationen, beziehungsweise Anionen, die
herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchti25 gen.

Es kommen als Kationen, insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, 30 vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch C1-C4-Alkyl oder Hydroxy-C1-C4-alkyl und/oder ein Phenyl oder Benzyl ersetzt sein können, vorzugsweise Ammonium, Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethyl-

35 benzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise  $Tri(C_1-C_4-alkyl)$  sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise  $Tri(C_1-C_4-alkyl)$  sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionsalzen sind in erster Linie 40 Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C1-C4-Alkansauren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

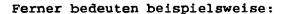
960970 O.Z. 0050/47679

5

Die für die Substituenten R<sup>1</sup>-R<sup>18</sup> oder als Reste an Phenylringen genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenwasserstoffketten, also alle Alkyl-, Halogen-5 alkyl-, Cyanoalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkyliminooxy-, Alkylthio-, Halogenalkylthio-, Alkylsulfinyl-, Halogenalkyl-sulfinyl-, Halogenalkylthio-, Halogenalkylsulfonyl-, Alkoxy-carbonyl-, Halogenalkoxycarbonyl, Alkenyloxy-, Alkinyloxy-, Dialkylamino-, Dialkylhydrazino-, Alkoxyalkyl-, Dialkoxyalkyl-, 10 Alkylthioalkyl-, Dialkylaminoalkyl-, Dialkylhydrazinoalkyl-, Alkyliminooxyalkyl-, Alkoxycarbonylalkyl- und Alkoxyalkoxy-Teile können geradkettig oder verzweigt sein. Sofern nicht anders angegeben tragen halogenierte Substituenten vorzugsweise ein

bis fünf gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung

15 Halogen steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod.



- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl: sowie die Alkylteile von Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, [2,2-Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-hydrazino-1]-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyliminooxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl: z.B. Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl;
- 25 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B.
  Pentyl; 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl,
  2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl,
  1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl,
  1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl,
  3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-3-methylpropyl;
- 35 · C<sub>1</sub>·C<sub>4</sub>·Halogenalkyl: einen C<sub>1</sub>·C<sub>4</sub>·Alkylrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Chlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor-
- difluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl, 2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl, 2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlor-
- propyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl, 1-(Fluor-



BASF Aktiengesellschaft 960970 0.Z. 0050/47679

methyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl und Nonafluorbutyl;

- 5 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentyl, 5-Chlorpentyl, 5-Brompentyl, 5-Iodpentyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Bromhexyl, 6-Iodhexyl und Dodecafluorhexyl;
- 10 C<sub>1</sub>·C<sub>4</sub>·Cyanoalkyl: z.B. Cyanomethyl, 1-Cyanoeth-1-yl,
  2-Cyanoeth-1-yl, 1-Cyanoprop-1-yl, 2-Cyanoprop-1-yl, 3-Cyanoprop-1-yl, 1-Cyanoprop-2-yl, 2-Cyanoprop-2-yl, 1-Cyanobut1-yl, 2-Cyanobut-1-yl, 3-Cyanobut-1-yl, 4-Cyanobut-1-yl,
  1-Cyanobut-2-yl, 2-Cyanobut-2-yl, 1-Cyanobut-3-yl, 2-Cyanobut-3-yl, 1-Cyano-2-methyl-prop-3-yl, 2-Cyano-2-methylprop-3-yl, 3-Cyano-2-methyl-prop-3-yl und 2-Cyanomethylprop-2-yl;
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy: sowie die Alkoxyteile von Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy) C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, z.B. Methoxy, Ethoxy, Propoxy, l-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy;
- C1-C6-Alkoxy: C1-C4-Alkoxy wie voranstehend genannt, sowie
   z.B. Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methoxylbutoxy, 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-l-methylpropoxy und 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- 35 C<sub>1</sub> · C<sub>4</sub> · Halogenalkoxy: einen C<sub>1</sub> · C<sub>4</sub> · Alkoxyrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Bromdifluormethoxy, 2 · Fluorethoxy, 2 · Chlorethoxy, 2 · Brommethoxy, 2 · Iodethoxy, 2 · 2 · Difluorethoxy, 2 · 2 · Trifluorethoxy, 2 · Chlor · 2 · fluorethoxy, 2 · Chlor · 2 · difluorethoxy,
  - 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy,
    2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluorethoxy, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy,
    3-Chlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluor-
- propoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy, Heptafluorpropoxy, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy,

**Best Available Copy** BASF Aktiengesellschaft 960970 1-(Chlormethy1)-2-chlorethoxy, 1-(Brommethy1)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy und Nonafluorbutoxy;  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy:  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentoxy, 5-Chlorpentoxy, 5-Brompentoxy, 5-Iodpentoxy, Undecafluorpentoxy, 6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Bromhexoxy, 6-Iodhexoxy und Dodecafluorhexoxy; 10 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyliminooxy: sowie die C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyliminooxyteile von C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyliminooxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, z.B. Methyliminooxy, Ethyliminooxy, 1-Propyliminooxy, 2-Propyliminooxy, 1-Butyliminooxy, 2-Butyliminooxy, 2-Methyl-prop-1-yliminooxy, 1-Pentyl-15 iminooxy, 2-Pentyliminooxy, 3-Pentyliminooxy, 3-Methylbut-2-yliminoxy, 2-Methyl-but-1-yliminooxy, 3-Methyl-

20

30

but-1-yliminooxy, 1-Hexyliminooxy, 2-Hexyliminooxy, 3-Hexyliminooxy, 2.Methyl-pent-1-yliminooxy, 3.Methyl-pent-1-yliminooxy, 4-Methyl-pent-1-yliminooxy, 2-Ethyl-but-1-yliminooxy, 3-Ethyl-but-1-yliminooxy, 2,3-Dimethyl-but-1-yliminooxy, 3-Methyl-pent-2-yliminooxy, 4-Methyl-pent-2-yliminooxy und

- 3,3-Dimethyl-but-2-yliminooxy;
- C1-C4-Alkylthio: z.B. Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methyl-25 propylthio und 1,1-Dimethylethylthio;



 $C_1-C_6$ -Alkylthio:  $C_1-C_4$ -Alkylthio wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentylthio, 1-Methylbutylthio, 2-Methylbutylthio, 3-Methylbutylthio, 2,2-Dimethylpropylthio, 1-Ethylpropylthio, Hexylthio, 1,1-Dimethylpropylthio, 1,2-Dimethylpropylthio, 1-Methylpentylthio, 2-Methylpentylthio, 3-Methylpentylthio, 4-Methylpentylthio, 1,1-Dimethylbutylthio, 1,2-Dimethylbutylthio, 1,3-Dimethylbutylthio, 2,2-Dimethylbutylthio,

- 35 2,3-Dimethylbutylthio, 3,3-Dimethylbutylthio, 1-Ethylbutylthio, 2-Ethylbutylthio, 1,1,2-Trimethylpropylthio, 1,2,2-Trimethylpropylthio, 1-Ethyl-1-methylpropylthio und 1-Ethyl-2-methylpropylthio;
- stehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Bromdifluormethylthio, 2-Fluorethylthio, 45 2-Chlorethylthio, 2-Bromethylthio, 2-Iodethylthio,
- 2,2-Difluorethylthio, 2,2,2-Trifluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio, 2-Chlor-2-fluorethylthio, 2-Chlor-2,2-di-

5

10

15

20

25

30

BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679

fluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, Pentafluor-ethylthio, 2-Fluorpropylthio, 3-Fluorpropylthio, 2-Chlorpropylthio, 3-Chlorpropylthio, 2-Brompropylthio, 3-Brompropylthio, 2,3-Dichlorpropylthio, 2,3-Difluorpropylthio, 2,3-Dichlorpropylthio, 3,3,3-Trichlorpropylthio, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylthio, Heptafluorpropylthio, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylthio, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylthio, 1-(Brommethyl)-2-bromethylthio, 4-Fluorbutylthio, 4-Chlorbutylthio, 4-Brombutylthio und Nonafluor-butylthio;

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentylthio, 5-Chlorpentylthio, 5-Brompentylthio, 5-Iodpentylthio, Undecafluorpentylthio, 6-Fluorhexylthio, 6-Chlorhexylthio, 6-Bromhexylthio, 6-Iodhexylthio und Dodecafluorhexylthio;

C1-C6-Alkylsulfinyl (C1-C6-Alkyl-S(=0)-): z.B. Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl, 1-Methylethylsulfinyl, Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl, 2-Methylpropylsulfinyl, 1,1-Dimethylethylsulfinyl, Pentylsulfinyl, 1-Methylbutylsulfinyl, 2-Methylbutylsulfinyl, 3-Methylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylpropylsulfinyl, 1,1-Dimethylpropylsulfinyl, 1,1-Dimethylpropylsulfinyl, 1,2-Dimethylpropylsulfinyl, Hexylsulfinyl, 1-Methylpentylsulfinyl, 2-Methylpentylsulfinyl, 3-Methylpentylsulfinyl, 4-Methylpentylsulfinyl, 1,1-Dimethylbutylsulfinyl, 1,2-Dimethylbutylsulfinyl, 1,3-Dimethylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylbutylsulfinyl, 2,3-Dimethylbutylsulfinyl, 3,3-Dimethylbutylsulfinyl, 1-Ethylbutylsulfinyl, 2-Ethylbutylsulfinyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfinyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfinyl, sulfinyl;

- C1·C6-Halogenalkylsulfinyl: C1·C6-Alkylsulfinylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor,
Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylsulfinyl, Difluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl,
Chlordifluormethylsulfinyl, Bromdifluormethylsulfinyl,
2-Fluorethylsulfinyl, 2-Chlorethylsulfinyl, 2-Bromethylsulfinyl,
40 finyl, 2-Iodethylsulfinyl, 2,2-Difluorethylsulfinyl,
2,2,2-Trifluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfinyl,
2-Chlor-2-fluorethylsulfinyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfinyl,
finyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfinyl, Pentafluorethylsulfinyl,
finyl, 2-Fluorpropylsulfinyl, 3-Fluorpropylsulfinyl, 2-Chlorpropylsulfinyl, 3-Chlorpropylsulfinyl, 2-Brompropylsulfinyl,
3-Brompropylsulfinyl, 2,2-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Dichlorpropylsulfinyl, 3,3,3-Trifluor-

```
BASF Aktiengesellschaft
                                    960970
                                                  O.Z. 0050/47679
         propylsulfinyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfinyl, 2,2,3,3,3-Pen-
         tafluorpropylsulfinyl, Heptafluorpropylsulfinyl, 1-(Fluor-
        methyl) -2-fluorethylsulfinyl, 1-(Chlormethyl) -2-chlorethyl-
         sulfinyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfinyl, 4-Fluorbutyl-
  5
        sulfinyl, 4-Chlorbutylsulfinyl, 4-Brombutylsulfinyl, Nonaflu-
        orbutylsulfinyl, 5-Fluorpentylsulfinyl, 5-Chlorpentylsulfi-
        nyl, 5-Brompentylsulfinyl, 5-lodpentylsulfinyl, Undecafluor
        pentylsulfinyl, 6-Fluorhexylsulfinyl, 6-Chlorhexylsulfinyl,
        6-Bromhexylsulfinyl, 6-Iodhexylsulfinyl und Dodecafluorhexyl-
 10
        sulfinyl;
        C_1 - C_6 - Alkylsulfonyl (C_1 - C_6 - Alkyl - S(=0)_2 -): 2.B. Methyl-
        sulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethyl-
        sulfonyl, Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methyl-
 15
        propylsulfonyl, 1,1-Dimethylethylsulfonyl, Pentylsulfonyl,
        1-Methylbutylsulfonyl, 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutyl-
        sulfonyl, 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Dimethylpropyl-
        sulfonyl, 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl,
        Hexylsulfonyl, 1-Methylpentylsulfonyl, 2-Methylpentyl-
20
        sulfonyl, 3-Methylpentylsulfonyl, 4-Methylpentylsulfonyl,
        1,1-Dimethylbutylsulfonyl, 1,2-Dimethylbutylsulfonyl,
        1,3-Dimethylbutylsulfonyl, 2,2-Dimethylbutylsulfonyl,
        2,3-Dimethylbutylsulfonyl, 3,3-Dimethylbutylsulfonyl,
        1-Ethylbutylsulfonyl, 2-Ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-Trimethyl-
25
        propylsulfonyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfonyl,
        1-Ethyl-1-methylpropylsulfonyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl-
        sulfonyl;
        C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyl: einen C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonylrest wie
30
        voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch
        Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B.
        Fluormethylsulfonyl, Difluormethylsulfonyl, Trifluormethyl-
        sulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl, Bromdifluormethylsulfo-
       nyl, 2-Fluorethylsulfonyl, 2-Chlorethylsulfonyl, 2-Bromethyl-
       sulfonyl, 2-Iodethylsulfonyl, 2,2-Difluorethylsulfonyl,
       2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl,
       2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl-
       sulfonyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl, Pentafluorethyl-
       sulfonyl, 2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl,
40
       2-Chlorpropylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl, 2-Brompropyl-
       sulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl, 2,2-Difluorpropylsulfonyl,
       2,3-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Dichlorpropylsulfonyl,
       3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl,
       2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfonyl, Heptafluorpropylsulfonyl,
45
       1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl, 1-(Chlormethyl)-2-
       chlorethylsulfonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfonyl,
```

4-Fluorbutylsulfonyl, 4-Chlorbutylsulfonyl, 4-Brombutylsulfo-

BASF Aktiengesellschaft 960970 o.z..005Q/47679 10 nyl, Nonafluorbutylsulfonyl, 5-Fluorpentylsulfonyl, 5-Chlorpentylsulfonyl, 5-Brompentylsulfonyl, 5-Iodpentylsulfonyl, 6-Fluorhexylsulfonyl, 6-Bromhexylsulfonyl, 6-Iodhexylsulfonyl und Dodecafluorhexylsulfonyl; C1-C4-Alkoxycarbonyl: z.B. Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propoxycarbonyl, 1-Methylethoxycarbonyl, Butoxycarbonyl, 1-Methylpropoxycarbonyl, 2-Methylpropoxycarbonyl und 1,1-Dimethoxycarbonyl; 10  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxycarbonyl: einen  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxycarbonyl, Difluormethoxycarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, Chlordifluormethoxycarbonyl, Bromdifluormethoxy-15 carbonyl, 2-Fluorethoxycarbonyl, 2-Chlorethoxycarbonyl, 2-Bromethoxycarbonyl, 2-Iodethoxycarbonyl, 2,2-Difluorethoxycarbonyl, 2,2,2-Trifluorethoxycarbonyl, 2-Chlor-2-fluorethoxycarbonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethoxycarbonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxycarbonyl, 2,2,2-Trichlorethoxycar-20 bonyl, Pentafluorethoxycarbonyl, 2-Fluorpropoxycarbonyl, 3-Fluorpropoxycarbonyl, 2-Chlorpropoxycarbonyl, 3-Chlorpropoxycarbonyl, 2-Brompropoxycarbonyl, 3-Brompropoxycarbonyl, 2,2-Difluorpropoxycarbonyl, 2,3-Difluorpropoxycarbonyl, 2,3-Dichlorpropoxycarbonyl, 3,3,3-Trifluorpropoxycar-25 bonyl, 3,3,3-Trichlorpropoxycarbonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxycarbonyl, Heptafluorpropoxycarbonyl, 1. (Fluormethyl)-2-fluorethoxycarbonyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxycarbonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxycarbonyl, 4-Fluorbutoxycarbonyl, 4-Chlorbutoxycarbonyl, 4-Brombutoxycarbonyl und 30 4-Iodbutoxycarbonyl; C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy: z.B. Prop-1-en-1-yloxy, Prop-2-en-1-yloxy, l-Methylethenyloxy, Buten-1-yloxy, Buten-2-yloxy, Buten-3-yloxy, 1-Methyl-prop-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-prop-1-en-1-yloxy, l-Methyl-prop-2-en-1-yloxy, 2-Methyl-prop-2-en-1-yloxy, Penten-1-yloxy, Penten-2-yloxy, Penten-3-yloxy, Penten-4-yloxy, 1-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 1-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 2-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 40 1-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 2-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-prop-1-en-2-yloxy, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yloxy, Hex-1-en-1-yloxy, Hex-2-en-1-yloxy, Hex-3-en-1-yloxy, 45 Hex-4-en-1-yloxy, Hex-5-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-1-en-1-yloxy,

```
960970
    BASF Aktiengesellschaft
                                                 O.Z. 0050/47679
                                  11
         4-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 2-Me-
        thyl-pent-2-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 4-Methyl-
        pent-2-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 2-Methyl-
        pent-3-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 4-Methyl-
        pent-3-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 2-Methyl-
  5
        pent-4-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 4-Methyl-
        pent-4-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1,1-Dime-
        thyl-but-3-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 1,2-Di-
        methyl-but-2-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy,
 10
        1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy,
        1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy,
        2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy,
        2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy,
        3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-but-1-en-1-yloxy,
 15
        1-Ethyl-but-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-but-3-en-1-yloxy, 2-Ethyl-
        but-1-en-1-yloxy, 2-Ethyl-but-2-en-1-yloxy, 2-Ethyl-
        but-3-en-1-yloxy, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yloxy,
        1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-l-yloxy, 1-Ethyl-2-methyl-
        prop-1-en-1-yloxy und 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-
 20
        yloxy;
        C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy: z.B. Prop-1-in-1-yloxy, Prop-2-in-1-yloxy,
        But-1-in-1-yloxy, But-1-in-3-yloxy, But-1-in-4-yloxy,
        But-2-in-l-yloxy, Pent-l-in-1-yloxy, Pent-l-in-3-yloxy,
25
        Pent-1-in-4-yloxy, Pent-1-in-5-yloxy, Pent-2-in-1-yloxy,
        Pent-2-in-4-yloxy, Pent-2-in-5-yloxy, 3-Methyl-but-1-in-
        3-yloxy, 3-Methyl-but-l-in-4-yloxy, Hex-l-in-1-yloxy,
        Hex-1-in-3-yloxy, Hex-1-in-4-yloxy, Hex-1-in-5-yloxy,
       Hex-l-in-6-yloxy, Hex-2-in-1-yloxy, Hex-2-in-4-yloxy,
30
       Hex-2-in-5-yloxy, Hex-2-in-6-yloxy, Hex-3-in-1-yloxy,
       Hex-3-in-2-yloxy, 3-Methylpent-1-in-1-yloxy, 3-Methyl-
       pent-1-in-3-yloxy, 3-Methyl-pent-1-in-4-yloxy, 3-Methyl-
       pent-1-in-5-yloxy, 4-Methyl-pent-1-in-1-yloxy, 4-Methyl-
       pent-2-in-4-yloxy und 4-Methylpent-2-in-5-yloxy;
       Di-(C_1-C_4-a1ky1)-amino: z.B. N,N-Dimethylamino, N,N-Diethyl-
       amino, N,N-Dipropylamino, N,N-Di-(1-methylethyl)amino, N,N-
       Dibutylamino, N,N-Di-(1-methylpropyl)amino, N,N-Di-(2-methyl-
       propyl) amino, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl) amino, N-Ethyl-N-
40
       methylamino, N-Methyl-N-propylamino, N-Methyl-N-(1-methyl-
       ethyl)amino, N-Butyl-N-methylamino, N-Methyl-N-(1-methyl-
       propyl)amino, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)amino,
       N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylamino, N-Ethyl-N-propylamino,
       N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-ethylamino,
45
       N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Ethyl-N-(2-methyl-
       propyl)amino, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino,
```

N-(1-Methylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-propylamino,

```
BASP Aktiengesellschaft
                                                     0,2..0050/47679
                                      960970
                                     12
         N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(2-Methylpropyl)-N-pro-
         pylamino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino, N-Bu-
          tyl-N-(1-methylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(1-
         methylpropyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl).
         amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)amino,
         N-Butyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Butyl-N-(2-methyl-
         propyl)amino, N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino,
         N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethyl-
         ethyl) -N-(1-methylpropyl) amino und N-(1,1-Dimethyl-
 10
         ethyl)-N-(2-methylpropyl)amino;
         [2,2.Di-(C1-C4-alkyl).hydrazino.1], sowie die Dialkylhydra-
         zino-Teile von [2,2-Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alky1)-hydrazino-1]-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alky1:
         z.B. 2,2-Dimethylhydrazino-1, 2,2-Diethylhydrazino-1, 2,2-Di-
 15
         propylhydrazino-1, 2,2-Di-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2,2-Di-
         butylhydrazino-1, 2,2-Di-(1-methylpropyl)hydrazino-1,
         2,2-Di-(2-methylpropyl)hydrazino-1, 2,2-Di-(1,1-dimethyl-
         ethyl)hydrazino-1, 2-Ethyl-2-methylhydrazino-1, 2-Methyl-2-
         propylhydrazino-1, 2-Methyl-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-
 20
         Butyl-2-methylhydrazino-1, 2-Methyl-2-(1-methyl-pro-
         pyl)hydrazino-1, 2-Methyl-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1,
         2-(1,1-Dimethylethyl)-2-methylhydrazino-1, 2-Ethyl-2-propyl-
         hydrazino-1, 2-Ethyl-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-
         ethylhydrazino-1, 2-Ethyl-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1,
 25
         2-Ethyl-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1,
         2-Ethyl-2-(1,1-dimethylethyl)hydrazino-1, 2-(1-Methyl-
        ethyl)-2-propylhydrazino-1, 2-Butyl-2-propylhydrazino-1,
        2-(1-Methylpropyl)-2-propylhydrazino-1, 2-(2-Methylpropyl)-2-
        propylhydrazino-1, 2-(1,1-Dimethylethyl)-2-propylhydrazino-1,
30
        2-Butyl-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-(1-Methyl-
        ethyl)-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1, 2-(1-Methyl-
        ethyl)-2-(2-methylpropyl)-hydrazino·1, 2-(1,1-Dimethyl-
        ethyl)-2-(1-methylethyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-(1-methyl-
        propyl)hydrazino-1, 2-Butyl-2-(2-methylpropyl)hydrazino-1,
        <del>2-Butyl-2-(1,1-dimethylethyl)hydrazino-1, 2-(1-Methyl-</del>
        propy1)-2-(2-methylpropy1)hydrazino-1, 2-(1,1-Dimethyl-
        ethyl)-2-(1-methylpropyl)hydrazino-1 und 2-(1,1-Dimethyl-
        ethyl) -2-(2-methylpropyl) hydrazino-1;
       Di \cdot (C_1 \cdot C_4 \cdot alky1) \cdot amino \cdot C_1 \cdot C_4 \cdot alky1: durch Di \cdot (C_1 \cdot C_4 \cdot alky1) \cdot C_1 \cdot (C_1 \cdot C_4 \cdot alky1) \cdot C_1 \cdot (C_1 \cdot C_4 \cdot alky1)
        amino wie voranstehend genannt substituiertes C1-C4-Alkyl,
        also z.B. N,N-Dimethylaminomethyl, N,N-Diethylaminomethyl,
        N, N. Dipropylaminomethyl, N, N. Di. (1-methylethyl) aminomethyl,
        N, N-Dibutylaminomethyl, N, N-Di-(1-methylpropyl)aminomethyl,
45
       N, N-Di-(2-methylpropyl)aminomethyl, N, N-Di-(1,1-dimethyl-
       ethyl)aminomethyl, N-Ethyl-N-methylaminomethyl, N-Methyl-N-
       propylaminomethyl, N-Methyl-N-(1-methylethyl)aminomethyl,
```

```
960970
                                                 0,Z. Q050/47679
    BASF Aktiengesellschaft
                                  13
        N-Butyl-N-methylaminomethyl, N-Methyl-N-(1-methyl-
        propyl)aminomethyl, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)aminomethyl,
        N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylaminomethyl, N-Ethyl-N-propyl-
        aminomethyl, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)aminomethyl, N-Butyl-N-
        ethylaminomethyl, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)aminomethyl,
        N-Ethyl-N-(2-methylpropyl) aminomethyl, N-Ethyl-N-(1,1-di-
        methylethyl)aminomethyl, N-(1-Methylethyl)-N-propylaminome-
        thyl, N-Butyl-N-propylaminomethyl, N-(1-Methylpropyl)-N-pro-
        pylaminomethyl, N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminomethyl,
10
        N-(1,1-dimethylethyl)-N-propylaminomethyl, N-Butyl-N-
        (1-methylethyl) aminomethyl, N-(1-Methylethyl) -N-(1-methyl-
        propyl)aminomethyl, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methyl-
        propyl)aminomethyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methyl-
        ethyl)aminomethyl, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)aminomethyl,
        N-Butyl-N-(2-methylpropyl)aminomethyl, N-Butyl-N-
15
        (1,1-dimethylethyl)aminomethyl, N-(1-Methylpro-
        pyl) -N-(2-methylpropyl)aminomethyl, N-(1,1-Dimethyl-
        ethyl) -N-(l-methylpropyl)aminomethyl, N-(l,1-Dimethyl-
        ethyl) -N-(2-methylpropyl)aminomethyl, 2-(N,N-Dimethylamino) -
        ethyl, 2-(N,N-Diethylamino) ethyl, 2-(N,N-Dipropylamino) -
20
        ethyl, 2-[N,N-Di-(1-methylethyl)amino]ethyl, 2-[N,N-Dibutyl-
        amino]ethy1, 2-[N,N-Di-(1-methylpropy1)amino]ethy1,
        2-[N, N-Di-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N, N-Di-(1,1-
       Dimethylethyl) amino] ethyl, 2-[N-Ethyl-N-methylamino] ethyl,
        2-[N-Methyl-N-propylamino]ethyl, 2-[N-Methyl-N-(1-methyl-
25
        ethyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-methylamino]ethyl, 2-[N-Me-
       thyl-N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-Methyl-N-(2-methyl-
       propyl)amino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methyl-
       amino]ethy1, 2-[N-Ethy1-N-propylamino]ethy1, 2-[N-Ethy1-
30
       N-(1-methylethyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-ethylamino]ethyl,
       2-[N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-
       (2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl-
       amino]ethyl, 2-[N-(1-Methylethyl)-N-propylamino]ethyl,
       2-[N-Butyl-N-propylamino]ethyl, 2-[N-(1-Methylpropyl)-N-pro-
       pylaminolethyl, 2-[N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino]ethyl,
       2-[N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino]ethyl,
       2-[N-Butyl-N-(1-methyl-ethyl)amino]ethyl, 2-[N-(1-Methyl-
       ethyl) -N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1-Methyl-
       ethyl) -N-(2-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethyl-
40
       ethyl) -N-(1-methylethyl) amino] ethyl, 2-[N-Butyl-N-(1-methyl-
       propyl)amino]ethyl, 2-[N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino]ethyl,
       2-[N-Butyl-N-(1,1-Dimethylethyl)amino]ethyl, 2-[N-(1-Methyl-
       propyl) - N - (2 - methylpropyl) amino] ethyl, 2 - [N - (1, 1 - Dimethyl -
       ethyl) -N-(1-methylpropyl)amino]ethyl, 2-[N-(1,1-Dimethyl-
```

ethyl) -N · (2 · methylpropyl) amino] ethyl, 3 · (N, N · Dimethyl ·

```
BASF Aktiengesellschaft
                                      960970
                                                     O.Z. 0050/47679
                                    14
         amino)propyl, 3-(N,N-Diethylamino)propyl, 4-(N,N-Dimethyl-
         amino)butyl und 4 · (N, N-Diethylamino)butyl;
         C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl: durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy wie vorstehend
         genannt substituiertes C1-C4-Alkyl, also z.B. für Methoxy-
         methyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, (1-Methylethoxy) methyl,
         Butoxymethyl, (1-Methylpropoxy)methyl, (2-Methyl-
         propoxy) methyl, (1,1-Dimethylethoxy) methyl, 2-(Methoxy) ethyl,
         2-(Ethoxy)ethyl, 2-(Propoxy)ethyl, 2-(1-Methylethoxy)ethyl,
 10
         2-(Butoxy)ethyl, 2-(1-Methylpropoxy)ethyl, 2-(2-Methyl-
         propoxy)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethyl, 2-(Methoxy)-
         propy1, 2-(Ethoxy)propy1, 2-(Propoxy)propy1, 2-(1-Methyl-
         ethoxy)propyl, 2-(Butoxy)propyl, 2-(1-Methylpropoxy)propyl,
         2-(2-Methylpropoxy)propyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl,
         3-(Methoxy)propyl, 3-(Ethoxy)-propyl, 3-(Propoxy)propyl,
 15
         3-(1-Methylethoxy)propyl, 3-(Butoxy)propyl, 3-(1-Methyl-
         propoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl, 3-(1,1-Dimethyl-
         ethoxy)propyl, 2-(Methoxy)-butyl, 2-(Ethoxy)butyl,
         2-(Propoxy)butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl, 2-(Butoxy)butyl,
 20
         2-(1-Methylpropoxy)butyl, 2-(2-Methylpropoxy)butyl,
         2-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 3-(Methoxy)butyl, 3-(Ethoxy)-
        butyl, 3-(Propoxy)butyl, 3-(1-Methylethoxy)butyl, 3-(Butoxy)-
        butyl, 3-(1-Methylpropoxy)butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl,
        3-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 4-(Methoxy)butyl,
25
        4-(Ethoxy)butyl, 4-(Propoxy)butyl, 4-(1-Methylethoxy)butyl,
        4-(Butoxy)butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl, 4-(2-Methyl-
        propoxy)butyl und 4-(1,1-Dimethylethoxy)butyl;
        C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl: durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio wie vorste-
30
        hend genannt substituiertes C1-C4-Alkyl, also z.B. für Methyl-
        thiomethyl, Ethylthiomethyl, Propylthiomethyl, (1-Methyl-
        ethylthio) methyl, Butylthiomethyl, (1-Methyl-propyl-
        thio) methyl, (2-Methylpropylthio) methyl, (1,1-Dimethylethyl-
        thio) methyl, 2-Methylthioethyl, 2-Ethylthioethyl, 2-(Propyl-
        thio)ethy1, 2-(1-Methylethylthio)ethyl, 2-(Butylthio)ethyl,
        2-(1-Methylpropylthio)ethyl, 2-(2-Methylpropylthio)ethyl,
        2-(1,1-Dimethylethylthio)ethyl, 2-(Methylthio)propyl,
        3-(Methylthio)propyl, 2-(Ethylthio)propyl, 3-(Ethyl-
        thio)propyl, 3-(Propylthio)propyl, 3-(Butylthio)propyl,
40
        4-(Methylthio)butyl, 4-(Ethylthio)butyl, 4-(Propylthio)butyl
       und 4-(Butylthio)butyl;
       C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl: durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl
       wie vorstehend genannt substituiertes C1-C4-Alkyl, also z.B.
45
       fur Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl, Propoxy-
       carbonylmethyl, (1-Methylethoxycarbonyl)methyl, Butoxy-
       carbonylmethyl, (1-Methylpropoxycarbonyl)methyl, (2-Methyl-
```

```
960970
                                                 O.Z. 0050/47679
    BASF Aktiengesellschaft
                                 15
        propoxycarbonyl) methyl, (1,1-Dimethylethoxycarbonyl) methyl,
        2-(Methoxycarbonyl)ethyl, 2-(Ethoxycarbonyl)ethyl, 2-(Prop-
        oxycarbonyl)ethyl, 2-(1-Methylethoxycarbonyl)ethyl,
        2-(Butoxycarbonyl)ethyl, 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)ethyl,
        2-(2-Methylpropoxycarbonyl)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy-
  5
        carbonyl) ethyl, 2-(Methoxycarbonyl) propyl, 2-(Ethoxy-
        carbonyl)propyl, 2-(Propoxycarbonyl)propyl, 2-(1-Methyl-
        ethoxycarbonyl)propyl, 2-(Butoxycarbonyl)propyl, 2-(1-Methyl-
        propoxycarbonyl)propyl, 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)propyl,
        2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propyl, 3-(Methoxycarbonyl)-
10
        propy1, 3-(Ethoxycarbonyl)propy1, 3-(Propoxycarbonyl)propy1,
        3-(1-Methylethoxycarbonyl)propyl, 3-(Butoxycarbonyl)propyl,
        3-(1-Methylpropoxycarbonyl)propyl, 3-(2-Methylpropoxy-
        carbonyl)propyl, 3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propyl,
        2-(Methoxycarbonyl)butyl, 2-(Ethoxycarbonyl)butyl, 2-(Prop-
15
        oxycarbonyl)butyl, 2-(1-Methylethoxycarbonyl)butyl,
        2-(Butoxycarbonyl)butyl, 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)butyl,
        2-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy-
        carbonyl)butyl, 3-(Methoxycarbonyl)butyl, 3-(Ethoxy-
        carbonyl)butyl, 3-(Propoxycarbonyl)butyl, 3-(1-Methylethoxy-
20
        carbonyl)butyl, 3-(Butoxycarbonyl)butyl, 3-(1-Methylpropoxy-
        carbonyl)butyl, 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl,
        3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butyl, 4-(Methoxycarbonyl)-
        butyl, 4-(Ethoxycarbonyl)butyl, 4-(Propoxycarbonyl)butyl,
        4-(1-Methylethoxycarbonyl)butyl, 4-(Butoxycarbonyl)butyl,
25
        4-(1-Methylpropoxy) butoxy, 4-(2-Methylpropoxy) butoxy und
        4-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butyl;
       C_1-C_4-Alkoxy-C_2-C_4-alkoxy: durch C_1-C_4-Alkoxy wie vorstehend
30
        genannt substituiertes C2-C4-Alkoxy, also z.B. für
        2-(Methoxy) ethoxy, 2-(Ethoxy) ethoxy, 2-(Propoxy) ethoxy,
       2-(1-Methylethoxy)ethoxy, 2-(Butoxy)ethoxy, 2-(1-Methyl-
       propoxy) ethoxy, 2-(2-Methylpropoxy) ethoxy, 2-(1,1-Dimethyl-
       ethoxy) ethoxy, 2-(Methoxy) propoxy, 2-(Ethoxy) propoxy,
       2-(Propoxy) propoxy, 2-(1-Methylethoxy) propoxy,
       2-(Butoxy)propoxy, 2-(1-Methylpropoxy)propoxy, 2-(2-Methyl-
       propoxy) propoxy, 2-(1,1-Dimethylethoxy) propoxy, 3-(Methoxy)-
       propoxy, 3-(Ethoxy) propoxy, 3-(Propoxy) propoxy, 3-(1-Methyl-
       ethoxy) propoxy, 3-(Butoxy) propoxy, 3-(1-Methy1-
40
       propoxy) propoxy, 3-(2-Methylpropoxy) propoxy, 3-(1,1-Dimethyl-
       ethoxy) propoxy, 2-(Methoxy) butoxy, 2-(Ethoxy) butoxy,
       2-(Propoxy)butoxy, 2-(1-Methylethoxy)butoxy, 2-(Butoxy)-
       butoxy, 2-(1-Methylpropoxy)butoxy, 2-(2-Methylpropoxy)butoxy,-
       2-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 3-(Methoxy)butoxy, 3-(Ethoxy)
45
       butoxy, 3-(Propoxy) butoxy, 3-(1-Methylethoxy) butoxy,
       3-(Butoxy)butoxy, 3-(1-Methylpropoxy)butoxy, 3-(2-Methyl-
```

propoxy)butoxy, 3-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 4-(Methoxy)-

O.Z. 0050/47679 960970 BASF Aktiengesellschaft 16 butoxy, 4-(Ethoxy)butoxy, 4-(Propoxy)butoxy, 4-(1-Methylethoxy) butoxy, 4-(Butoxy) butoxy, 4-(1-Methylpropoxy) butoxy, 4-(2-Methylpropoxy)butoxy und 4-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy; C2-C6-Alkandiyl: z.B. Ethan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Butan-1,4-diyl, Pentan-1,5-diyl und Hexan-1,6-diyl; C3-C8-Cycloalkyl: z.B. Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl oder Cyclooctyl; 10 Alle Phenylringe sind vorzugsweise unsubstituiert oder tragen ein bis drei Halogenatome und/oder eine Nitrogruppe, einen Cyanorest und/oder einen oder zwei Methyl-, Trifluormethyl-, Methoxy- oder Trifluormethoxysubstituenten. 15 In Hinblick auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I als Herbizide haben die Variablen vorzugsweise folgende Bedeutungen, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination: 20 R1, R2 Nitro, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio, C1-C6-Halogenalkylthio, C1-C6-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl oder 25  $C_1 \cdot C_6 \cdot Halogenalkylsulfonyl;$ besonders bevorzugt Nitro, Halogen, wie z.B. Chlor und Brom, C<sub>1</sub>·C<sub>6</sub>·Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, wie z.B. Methoxy und Ethoxy, C1-C6-Halogenalkyl, wie z.B. Difluormethyl und Tri-30 fluormethyl, C1-C6-Alkylthio, wie z.B. Methylthio und Ethylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, wie z.B. Methylsulfinyl und Ethylsulfinyl, C1-C6-Alkylsulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl und Propylsulfonyl oder C1-C6-Halogenalkylsulfonyl, wie z.B. Trifluormethylsulfonyl und Pentafluorethylsulfonyl;  $\mathbb{R}^3$ Wasserstoff; R4, R5 Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C1-C4-Alkyl,  $C_1 \cdot C_4 \cdot Alkoxy \cdot C_1 \cdot C_4 \cdot alkyl$ ,  $Di \cdot (C_1 \cdot C_4 \cdot alkoxy) \cdot C_1 \cdot C_4 \cdot alkyl$ , 40  $Di \cdot (C_1 \cdot C_4 \cdot alkyl) \cdot amino \cdot C_1 \cdot C_4 \cdot alkyl$ ,  $[2, 2-Di-(C_1-C_4-alkyl)-hydrazino-1]-C_1-C_4-alkyl,$  $C_1 \cdot C_6 \cdot Alkyliminooxy \cdot C_1 \cdot C_4 \cdot alkyl, C_1 \cdot C_4 \cdot Alkoxycarbo$ 

 $nyl-C_1-C_4-alkyl$ ,  $C_1-C_4-Alkylthio-C_1-C_4-alkyl$ ,

alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Cyanoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl,  $C_1-C_4-A1koxy$ ,  $C_1-C_4-A1koxy-C_2-C_4-a1koxy$ ,  $C_1-C_4-Halogen$ 

O.Z. 0050/47679 BASF Aktiengesellschaft 960970 17 Di-(C1-C4-alkyl)-amino, COR6, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letzgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: 5 Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>·C<sub>4</sub>·Alkyl, C<sub>1</sub>·C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C1.C4.Alkoxy oder C1.C4.Halogenalkoxy; oder 10 R4 und R5 bilden gemeinsam eine C2-C6-Alkandiyl-Kette, die ein bis vierfach durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C1-C4-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann: 15 besonders bevorzugt steht R4 für Wasserstoff,  $C_1 - C_4 - Alkyl$ ,  $C_1 - C_4 - Halogenalkyl$ ,  $C_1 - C_4 - Alkoxycarbonyl$ oder CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>; besonders bevorzugt steht R5 für Wasserstoff oder 20 C1-C4-Alkyl; oder besonders bevorzugt bilden R4 und R5 eine C2-C6-Alkandiyl-Kette, die ein bis vierfach durch C1-C4-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C1-C4-Alkyl substituierten Stick-25 stoff unterbrochen sein kann; C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>; R6 30 R7 Wasserstoff oder C1-C4-Alkyl; R8  $C_1-C_4-Alkyl;$ X O, S, NR9, CO oder CR10R11; O, S, NR12 oder CR13R14;  $R^9$ ,  $R^{12}$ Wasserstoff oder C1-C4-Alkyl; 40 R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, R13, R14 Wasserstoff, C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxycarbonyl, C1-C4-Halogenalkoxycarbonyl oder CONR7R8;

oder

	٠	BASF Akt	iengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679
	·	R <sup>4</sup> und R <sup>9</sup>	gemeinsam eine $C_2$ - $C_6$ -Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch $C_1$ - $C_4$ -Alkyl substituiert sein kann und/
	5		oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C1-C4-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein
			kann;
	10	R16	C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkyl; besonders bevorzugt Methyl, Ethyl, Propyl, 2-Methyl- propyl oder Butyl;
· ·. •		Z	H oder SO <sub>2</sub> R <sup>17</sup> ;
	15	R <sup>17</sup>	C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl, Phenyl oder Phenyl, das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen trägt:
			Nitro, Cyano, $C_1 \cdot C_4 \cdot Alkyl$ , $C_1 \cdot C_4 \cdot Halogenalkyl$ , $C_1 \cdot C_4 \cdot Alkoxy$ oder $C_1 \cdot C_4 \cdot Halogenalkoxy$ ;
	20	R18	Wasserstoff oder C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkyl; besonders bevorzugt Wasserstoff oder Methyl.
	25		Ausführungsformen der 3-Heterocyclyl-substituierten rivate der Formel I sind hervorzuheben:
	25		ner bevorzugten Ausführungsform der 3-Heterocyclyl-sub- ierten Benzoylderivate der Formel I steht Z für SO <sub>2</sub> R <sup>17</sup> .
	30	t	esonders bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substi- uierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R <sup>18</sup> für Was- erstoff steht.
		. 5	benso besonders bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl- ubstituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R <sup>18</sup> für
	35	М	ethyl steht.
·		*	Insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocylylsubstituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei $\mathbb{R}^{17}$ für $C_1$ - $C_4$ -Alkyl steht.
	40	2. In ein	ner weiteren bevorzugten Ausführungsform der 3-Heterocy-

clyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I steht Z für

Wasserstoff.

*-	BASF	Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679	
		19	
•	-	Besonders bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei X für Sauer-	•
		stoff und Y für CR <sup>13</sup> R <sup>14</sup> stehen.	
5		* Insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl- substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei	
	· _ · · ·	R <sup>4</sup> Halogen, Nitro, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alk-	<del></del>
	•	oxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl, $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbo-	
10		$ny1-C_1-C_4-alky1$ , $C_1-C_4-Alky1thio-C_1-C_4-alky1$ ,	
10			•
•		C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Cyanoalkyl,	
•	·	C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> -Cycloalkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkoxy, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alk-	
·		oxy-C <sub>2</sub> -C <sub>4</sub> -alkoxy, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkoxy,	
		C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkylthio, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkylthio,	
15		Di-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -alkyl)-amino, COR <sup>6</sup> , Phenyl oder Benzyl,	
		wobei die beiden letztgenannten Substituenten	
	•	partiell oder vollständig halogeniert sein	
4		können und/oder eine bis drei der folgenden	
		Gruppen tragen können:	
20		Nitro, Cyano, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkoxy oder C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkoxy;	
		R <sup>5</sup> Wasserstoff oder C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl;	
25	•	oder_	
•		R4 und R5 bilden gemeinsam eine C2-C6-Alkandiyl-	
		Kette, die ein- bis vierfach durch C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl	
		substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff	
30		oder einen gegebenenfalls C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl substi- tuierten Stickstoff unterbrochen sein kann;	
		tulerten Stickstoff unterblochen bein kami,	
		oder	
35		R <sup>5</sup> und R <sup>13</sup> bilden gemeinsam eine C <sub>2</sub> ·C <sub>6</sub> -Alkandiyl-	
		Kette, die ein- bis vierfach durch C1-C4-Alkyl	
		substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff	
,		oder einen gegebenenfalls C1 · C4 · Alkyl substi-	
		tuierten Stickstoff unterbrochen sein kann;	
40	<b>-</b> .	bedeuten:	
			٠
		Außerordentlich bevorzugt-sind-hierbei 3-Hetero-	
		cyclyl-substituierte Benzoylderivate der	
45		Formel I, wobei	

	BASF Aktie	ngesellschaft	960970	O.Z. 0050/47679	•••
		R4 C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl carbonyl od		ilkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkoxy-	<b>.</b>
	5	R <sup>5</sup> Wasserstoff	oder C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alk	yl;	
		oder		0	
10	0	Kette, die substituier oder einen	ein- bis vierfa t sein kann und gegebenenfalls	ne C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -Alkandiyl- ch durch C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl /oder durch Sauerstoff C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl substi- rochen sein kann;	-
1!	5 .	oder			• . •
	÷	Kette, die o substituier oder einen o	ein- bis vierfa t sein kann und gegebenenfalls	ine C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -Alkandiyl- ch durch C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl /oder durch Sauerstoff C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl substi-	
2(	0	tuierten St	ickstoff unterb	rochen sein kann;	
2!	5		substituierte Bo	rzugt sind hierbei enzoylderivate der For- f steht.	
30	*		ituierte Benzoy	sind hierbei auch 3-He- /lderivate der Formel off stehen.	
	•	cyclyl-subst		sind hierbei 3-Hetero- ylderivate der Formel f steht.	e e
-	=		y1-substituier	pevorzugt sind hierbei te Benzoylderivate der	
40		Ethyl, ( Ethoxy, methyl (	C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkoxy, wi C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Halogenal and Trifluormet	z.B. Methyl und le z.B. Methoxy und lkyl wie z.B. Difluor- hyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkyl-	-
45	٠.			hylsulfonyl und Ethyl- logenalkylsulfonyl,	

21 z.B. Trifluormethylsulfonyl und Pentafluorethylsulfonyl; bedeutet. 5 Ebenso besonders außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei 10 R<sup>2</sup> Nitro, Halogen, wie z.B. Chlor und Brom, C1-C6-Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, wie z.B. Difluormethyl und Trifluormethyl, C1-C6-Alkylthio wie z.B. Methylthio und Ethylthio, C1-C6-Alkyl-15 sulfinyl, wie z.B. Methylsulfinyl und Ethylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl und Propylsulfonyl oder C1-C6-Halogenalkylsulfonyl, wie z.B. Trifluomethylsulfonyl und Penta-20 fluorethylsulfonyl; bedeuten. Ebenso besonders außerordentlich bevorzugt ist 25 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4methylsulfonyl-benzoyl]-1-methyl-5-hydroxy-1Hpyrazol. Ebenso außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der 30 Formel I, wobei R18 für Methyl steht. Besonders außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I, wobei R1 Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, wie z.B. Methyl und Ethyl, C1-C6-Alkoxy, wie z.B. Methoxy und Ethoxy, C1-C6-Halogenalkyl wie z.B. Difluormethyl und Trifluormethyl, C1-C6-Alkylsulfonyl, wie z.B. Methylsulfonyl-und Ethylsulfonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyl, z.B. Trifluormethylsulfonyl-und-Pentafluorethylsulfonyl;

bedeutet.

		BASF	Aktien	gesells	chaft	960970		O.Z. 005	0/47679		
						22	• • •		•• •••	•••	•
		•		Ebe	nso besc	onders auß	erorde	ntlich bev	orzugt s	ind	2
	,	•		hie	rbei 3-H	eterocycl:	yl-sub:	stituierte	Benzoyl	•	
				der	ivate de	er Formel	I, wobe	ei	· ·		
•						•		•			
	5		· · ·	R <sup>2</sup>	Nitro,	Halogen,	wie z.	B. Chlor	ind Brom,		
- 11					C1-C6-A	lkyl, wie	z.B. M	ethyl und	Ethyl,		
						alogenalky					
						lfluormeth	-	_		z.B.	
	·		•	j .	•	thio und E		<del>-</del>			
	10					/l, wie z.				hyl -	
•						$/1, C_1-C_6-A$	_	_			
						sulfonyl,					
						oder C <sub>1</sub>					
1						. Trifluo	_	sulfonyl u	ind Penta	8	
	15				fluoret	hylsulfon	yl;				
			. ,	bede	eutet.			•			
			<b>53.</b>		a b			L-4 7 Wat		,	
r · ·	20	•				orzugt si				T -	
	20		sws	ciculerc	e Benzoy	lderivate	der ro	ormel 1, w	ODEI	,	
			x	für S, N	R <sup>9</sup> , CO o	der CR <sup>10</sup> R <sup>1</sup>	1;				· .
	•		oder		•			•			·
•	25		Ouel								
			Y	für 0, S	, NR <sup>12</sup> O	der CO;			-		
			1				-				
			steh	en.							
1	20		•	Tachacas	Jana have	orzugt sin	ad biox	bol. 2 - Hot	orogumly	٦.	
	30					nzoylderi					
				für Wasse			vace de	er rormer	1, 40001	**	
				LUI MUSS	SIBLUAL	Beene.	•	:			
			* .;	Ebenso i	sbesonde	ere bevorz	zuat si	nd hierbe	i 3-Hete	ro-	
·	35					erte Benzo	_				
				. – –		C <sub>6</sub> -Alkyl k				· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	
					•						
			- (	Auße	rordentl	ich bevor:	zugt si	ind hierbe	i 3-Hete	ro-	
			•			ituierte l	_				
•	40	. • . –	<u>.</u>	Í, W							
						····					
				R4	Halogen,	Cyano, N	itro, (	C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alky	1,		
						koxy-C1-C4		_		0	
						4-alkyl, C					<del></del>
•	45	•				logenalkyl				•	
						cloylkyl,	_				
				(	ожу-С <sub>1</sub> -С	-alkoxy,	C1-C4-1	Halogenal	coxy,		
,	•										

•	BASI	Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679
,		23 C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkylthio, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkylthio, Di-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -alkyl)-amino, COR <sup>6</sup> , Phenyl oder
	•	Benzyl, wobei die beiden letztgenannten
		Substituenten partiell oder vollständig ha-
	5	logeniert sein können und/oder eine bis drei
		der folgenden Gruppen tragen können:
		Nitro, Cyano, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogen-
٠.		alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkoxy oder C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkoxy;
	10	R <sup>5</sup> Wasserstoff oder C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl;
		oder
1	15	R4 und R <sup>5</sup> bilden gemeinsam eine C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -Alkandiyl- Kette, die ein- bis vierfach durch
	13	C1-C4-Alkyl substituiert sein kann und/oder
	\	durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls
		C1-C4-Alkyl substituierten Stickstoff unter-
		brochen sein kann;
	20	Descrient Belli italia,
		oder
•		R <sup>4</sup> und R <sup>9</sup> oder R <sup>4</sup> und R <sup>10</sup> oder R <sup>5</sup> und R <sup>12</sup> oder R <sup>5</sup>
	•	und R <sup>13</sup> bilden gemeinsam eine C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -Alkan-
	25	diyl-Kette, die ein bis vierfach durch
	23	C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl substituiert sein kann und/oder
		durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls
_		C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl-substituierten Stickstoff unter-
		brochen sein kann;
<b>€</b> Å	30	
		bedeuten.
	•	<ul> <li>Ebenso insbesondere bevorzugt sind hierbei 3-Hetero-</li> </ul>
_		cyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I,
	35	wobei
		X für S, NR <sup>9</sup> oder CO
		oder
. ,	40 .	y fûr O, NR <sup>12</sup> oder CO
		Außerordentlich bevorzugt sind hierbei 3-Hetero-
		cyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel
	45	I, wobei

				24
			R4	Halogen, Cyano, Nitro, $C_1 \cdot C_4 \cdot Alkyl$ , $C_1 \cdot C_4 \cdot Alkyl$ , $C_1 \cdot C_4 \cdot Alkyl$ , $C_1 \cdot C_4 \cdot Alkoxycarbo$
				$ny1-C_1-C_4-alky1$ , $C_1-C_4-Alky1$ thio- $C_1-C_4-Alky1$ ,
	•			C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Cyanoylkyl,
5		<u> </u>		C3-C8-Cycloylkyl, C1-C6-Alkoxy, C1-C4-Alko-
			·	xy-C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -alkoxy, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkoxy,
			•	C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkylthio, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkylthio,
				Di-(C1-C4-alkyl)-amino, COR6, Phenyl oder
				Benzyl, wobei die beiden letztgenannten
10	•			Substituenten partiell oder vollständig ha-
				logeniert sein können und/oder eine bis drei
		•		der folgenden Gruppen tragen können:
				Nitro, Cyano, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogen-
15	*	`	•	alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkoxy oder C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkoxy;
		•	R <sup>5</sup>	Wasserstoff oder C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl;
			ode	•
20			R <sup>4</sup>	und $R^5$ bilden gemeinsam eine $C_2$ - $C_6$ -Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch $C_1$ - $C_4$ -Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls
25				C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;
			oder	
30			R <sup>4</sup>	und $R^9$ oder $R^4$ und $R^{10}$ oder $R^5$ und $R^{12}$ oder $R^5$ und $R^{13}$ bilden gemeinsam eine $C_2$ - $C_6$ -Alkandiyl-Kette, die ein bis vierfach durch
				C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls
<del>-35</del>		·		C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl·substituierten Stickstoff unter- brochen sein kann;
			Dege	uten.

960970

.z. 0050/47679

67,9

25

Insbesondere außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen Ial ( $\cong$  I mit  $R^1$  = C1,  $R^2$  = SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,  $R^3$  = H,  $R^{16}$ ,  $R^{18}$  = CH<sub>3</sub>, Z=H), insbesondere die Verbindungen der Tabelle 1.

			•	,		
		Tabelle	<b>1</b>	•		
	15:	Nr.	X -	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Y
		Ta1.1	CH <sub>2</sub>	Н	CH₃	0
i i		la1.2	CH <sub>2</sub>	H	н	0
		la1.3	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	Н	0
	20	Ta1.4	CH <sub>2</sub>	. H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0
		la1.5	CH₂	CH₃	CH <sub>3</sub>	0
		la1.6	CH(CH <sub>3</sub> )	Н	CH <sub>3</sub>	0
		la1.7	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H	CH <sub>3</sub>	0
-		la1.8	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]	H	H	0
* -	25	la1.9	CH <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
*		Ta1.10	CH(C₂H₅)	Н	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0
		Ta1.11	-CH-	(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> —	H	0
		la1.12	C=O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0
		la1.13	C=O	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0
		Ta1.14	C=O	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C₂H₅	0
	30	la1.15	C=0	Н	Н	0
		la1.16	C=O	H	CH <sub>3</sub>	0
		la1.17	CH <sub>2</sub>	* H	CH <sub>3</sub>	ड
		la1.18	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	S
		la1.19	CH <sub>2</sub>	Н	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S
	35	la1.20	CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S
	- 1	Ta1.21	CH(CH <sub>3</sub> )	Н	CH <sub>3</sub>	S
	ſ	la1.22	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	н	CH₃	S
	ſ	la1.23	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	Н	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S
		la1.24	-CH-(	CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> —	H	S
_ / .	40	la1.25	CH(CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H		\$
	ĵ	la1.26	CH <sub>2</sub>	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S
	. 1	la1.27	CH <sub>2</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	NH
	- 1	Ta1-28-	CH <sub>2</sub>	·	H	NH
	Ī	Ta1.29	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Н	NH
•• .	45	la1.30	CH <sub>2</sub>	Н	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NH
	ı	Ta1.31	CH <sub>2</sub>	CH₃	CH₃	NH
	t	la1.32	CH(CH <sub>3</sub> )	Н	CH₃	NH

		BASF Aktiengesellschaf		Et 960970 :.	960970 O.Z. 0050/4		
				26			
		Nr.	x	R4	R <sub>5</sub>	TY	
		la1.33	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	н	CH <sub>3</sub>	NH	
	ı	Ta1.34	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NH	
	5	Ta1.35		CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	H	NH	
		Ta1.36	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]	H	H	NH	
-+		Ta1.37	CH <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	NH	
		Ia1.38	CH <sub>2</sub>	H	. CH₃	NCH <sub>3</sub>	
		la1.39	CH <sub>2</sub>	Н	Н	NCH <sub>3</sub>	
	10	Ta1.40	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Н	NCH <sub>3</sub>	
	10	Ta1.41	CH <sub>2</sub>	Н	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NCH <sub>3</sub>	
•		la1.42	CH <sub>2</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	
		la1.43	CH(CH <sub>3</sub> )	Н	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	
		Ta1.44	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H	CH <sub>3</sub>	NCH₃	
	15	la1.45	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]	H	Н	NCH₃	
		la1.46	CH <sub>2</sub>	Н	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	NCH <sub>3</sub>	
. 1		la1.47	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	Н	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NCH <sub>3</sub>	
		la1.48		H-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	H	NCH₃	
		la1.49	CH <sub>2</sub>	Н	CH₃	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	20	la1.50	CH₂	Н	H	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	20	la1.51	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
		la1.52	CH₂	Н	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
		la1.53	CH₂	CH₃	CH <sub>3</sub>	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
		la1.54	CH(CH <sub>9</sub> )	H	CH₃	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
٠.	25	la1.55	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H	CH₃ H	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	23	la1.56	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]	H H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
		la1.57	CH <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
_		la1.58	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	1-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	H	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
		la1.59	CH₂		- ''	S S	
	30	la1.60	CH(CH <sub>3</sub> )		0	<del>-</del> - <del>S</del> -	
<b>9</b> /_	30	la1.62	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )		0	S	
		la1.63	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]		<u>0</u>	S	
		Ta1.64	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		<u> </u>	S	
		la1.65	CCH <sub>3</sub> (C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )		<u>=</u> O	S	
	35	1a1.66	CCH <sub>3</sub> (CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		<u>:</u> O	S	
		la1.67	CH <sub>2</sub>		·O .	NH	
		la1.68	CH(CH <sub>3</sub> )	*	:0	NH ·	
		la1.69	CH(C₂H₅)	=	:0	NH	
		la1.70	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]		:0	NH	
	40	Ta1.71	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	=	:O	NH	
		la1.72	CCH <sub>3</sub> (C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )		Θ	NH	
		la1.73	CCH <sub>3</sub> [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]		:O	NH	
	.	la1.74	CH₂		:0	NCH <sub>3</sub>	
		la1.75	CH(CH <sub>3</sub> )		0	NCH <sub>3</sub>	
	45	la1.76	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )		:0	NCH <sub>3</sub>	
		la1.77	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]		:O	NCH₃	
		1a1.78	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		:0	NCH₃	

	BASF A	ktiengesellscha	ft 960970	O.Z. 0050/47	679
• .					
			27	• • • • • •	•••
	Nr.	X	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	
	la1.79	CCH <sub>3</sub> (C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	=	=0	NCH <sub>3</sub>
	la1.80	CCH <sub>3</sub> (CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )		<b>=</b> O	NCH <sub>3</sub>
	5 la1.81	0	COOCH <sub>3</sub>	H .	CH <sub>2</sub>
	la1.82	0	COOC₂H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>
	121.83	0	CONHCH <sub>3</sub>	H	CH₂
	Ta1.84	0	CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	CH <sub>2</sub>
	Ta1.85	0	CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Н	CH <sub>2</sub>
1	o la1.86	0	CON(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Н	CH <sub>2</sub>
_	la1.87	0	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>
0	la1.88	0 .	C₂H₅	H	CH₂
	1a1.89	. 0	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub>
	la1.90	0	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	i i i i i i i i i i i i i i i i i i i	CH <sub>2</sub>
· 1	s la1.91	0	CH <sub>2</sub> CN	H	CH <sub>2</sub>
	la1.92	0.	CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub>
	la1.93	0	CH <sub>2</sub> ON=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	CH <sub>2</sub>
	la1.94	0	CH(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Н	CH <sub>2</sub>
	la1.95	0	CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub>
20	la1.96	. 0	CH <sub>3</sub>	CH₃	CH <sub>2</sub>
	la1.9/	0	CH₃	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>
	la1.98	0	C₂H₅	C₂H₅	CH <sub>2</sub>
	la1.99	0		12)4-	CH <sub>2</sub>
	la1.100	0		)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	CH₂
-25	la1.102	0	H	(CH <sub>2</sub> )₃CH	
	la1.102	0	CH <sub>3</sub>	–(CH₂)₄–CH H	_ CHCH₃
	la1.104	S	——————————————————————————————————————		0
	la1.105	CH₂	=		S
	1a1.106	CH(CH <sub>3</sub> )	=		S
30		CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	=		S
	la1.108	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	=		S
	Ia1.109	0	=(		NH
	Ta1.110	0	=(		NCH₃
_	Ta1.111	0	CH <sub>3</sub>	H	NH
35	la1.112	0	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	NH
	Ta1.113	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH
٠,	la1.114	0	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NH
	la1.115	0	CH <sub>3</sub>	Н	NCH <sub>3</sub>
	Ia1.116	0	C₂H₅	Н	NCH <sub>3</sub>
40		0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>
	la1.118	0	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NCH <sub>3</sub>
	la1.119	NH	=(		NH
	la1.120	NH		)	NCH <sub>3</sub>
	la1.121	NCH <sub>3</sub>	=0		NH
45	la1.122	NCH₃	=C		NCH <sub>3</sub>
	la1.123	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	=0		NH
•	la1.124	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	=0	1	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

960970 O.Z. 0

0.2. 0050/47679

28

Desweiteren sind folgende Benzoylderivate der Formel I insbesondere außerordentlich bevorzugt:

 die Verbindungen Ia2.1-Ia2.124, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ia1.1-Ia1.124 dadurch unterscheiden, daß R<sup>16</sup> für Ethyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

10

$$\begin{array}{c|c}
O & CI & N-X & R^4 \\
N & N & OH & SO_2CH_3
\end{array}$$

15

Ebenso insbesondere außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen Ib1 ( $\ominus$  I mit  $R^1$ ,  $R^2$  = C1,  $R^3$  = H,  $R^{16}$ ,  $R^{18}$  = CH<sub>3</sub>, Z = H) insbesondere die Verbindungen der Tabelle 2

20

Tabelle 2

		·		•	
30	Nr.	X	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	TY
	161,1	CH₂	Н	CH₃	0
	161.2	CH <sub>2</sub>	R	н	0
	lb1.3	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Н	0
35	151.4	CH₂	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0
	1b1.5	CH₂	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0
	lb1.6	CH(CH <sub>3</sub> )	H	CH₃	0
	lb1.7	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H	CH <sub>3</sub>	0
	lb1.8	CH(CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )	Н	Н	0
40	lb1.9	CH <sub>2</sub>	Н	CH(CH <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>	0
40	1b1.10	CH(C₂H₅)		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O
	ТБ1.11	-CH-(CI	H <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	H	0
	161.12	C=O	CH <sub>3</sub>	CH₃	0,
	161.13	C=O		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0
	1b1.14	C=O	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0
45	<b>161.15</b>	C=O	H	H	0
	1b1.16	C=O	H	CH <sub>3</sub>	0
	lb1.17	CH₂	H	CH <sub>3</sub>	S

	BASF A	ctiengesellscha	Et 960970	o.z. 0050/4	7679	
		**	29	• • • •	• •••	••
÷	Nr.	X	R⁴	R⁵	Y	
	1b1.18	CH <sub>2</sub>	<del>                                       </del>	H	8	
	Ib1.19	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Н	S	
5	11.2 AX	CH <sub>2</sub>	н	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
	lb1.21	CH <sub>2</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>	8	
	151.22	CH(CH <sub>3</sub> )	H	CH <sub>3</sub>	S	
	lb1.23	CH(C₂H₅)	H	CH₃	S	
•	151.24	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	Н	C₂H₅	S	
10	151 25	-CH-(	CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> —	Н	S	
10	lb1.26	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]	H	H	S	
•	ТБ1.27	CH <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	
	151.28	CH <sub>2</sub>	Н	CH <sub>3</sub>	NH	•
	151.29	CH <sub>2</sub>	Н	H	NH	
15	161.30	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	NH	
15	151.31	CH <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NH	
	lb1.32	CH₂	CH <sub>3</sub>	CH₃	NH	
	Ib1.33	CH(CH <sub>3</sub> )	H	CH₃	NH	
	<b>Т</b> Б1.34	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H	CH <sub>3</sub>	NH	
20	Tb1.35	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	Н	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NH	
20	101.30		CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> —	H	NH NH	
	lb1.37	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]	Н	H	NH	
	lb1.38	CH <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> )₂	NCH <sub>3</sub>	•
	lb1.39	CH <sub>2</sub>	Н	CH₃ H	NCH <sub>3</sub>	
25	lb1.40	CH <sub>2</sub>	H	H	NCH <sub>3</sub>	
23	ן וד.וטון	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NCH <sub>3</sub>	•
	Ib1.42	CH₂ CH₂	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	
	161.43 161.44	CH(CH <sub>3</sub> )	H	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	
	1b1.45	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H	CH₃	NCH <sub>3</sub>	
30	1b1.46		н	Н Н	NCH <sub>3</sub>	
	1b1.47	CH <sub>2</sub>	H	CH(CH₃)₂	NCH <sub>3</sub>	
	Ib1.48	CH(C₂H₅)	H	C₂H₅	NCH <sub>3</sub>	·
	Ib1.49	-C	H-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	Н	NCH <sub>3</sub>	
	151.50	CH <sub>2</sub>	H	CH₃	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
35		CH <sub>2</sub>		H	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-
-	lb1.52	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	Н	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	lb1.53	CH <sub>2</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	151.54	CH <sub>2</sub>	CH₃	CH₃	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
. •	lb1.55	CH(CH <sub>3</sub> )	Н	CH₃	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
4.0_	Ib1.56	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H	CH <sub>3</sub>	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	Ib1.57	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]	· H	H	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<b>-</b> -
-	ТЬ1.58	CH <sub>2</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	•
	lb1.59	CH(C₂H₅)	H	G <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	lb1.60		F-(CH <sub>2</sub> )₄	R	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
45	lb1.61	CH <sub>2</sub>	_	0	S	
	lb1.62	CH(CH <sub>3</sub> )		0	S	•
	lb1.63	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	=	0	S	

	BASF Ak	tiengesellschaf	Et 960970	Q.Z. 0050/4	7679	<b>:                                    </b>
			30			•
	Nr.	X	R⁴	A2	Y	e.
	lb1.64	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]	=	0	S	
	Ib1.65	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	=	:0	S	•
	5 lb1.66	CCH <sub>3</sub> (C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	=	:O	S	
	Ib1.67	CCH <sub>3</sub> [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]	=	:O	S	
	lb1.68	CH <sub>2</sub>	L .	0	NH	•
•	161.69	CH(CH <sub>3</sub> )		•O	NH	
	151.70	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	1	:0	NH	•
1	.0 Ib1.71	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]		:O	NH	
•	Ib1.72	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		:O	NH	•
	lb1.73	CCH <sub>3</sub> (C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	1 '	·O	NH	
	161.74	CCH <sub>3</sub> [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]		:0	NH	
*	lb1.75	CH₂	1	:0	NCH₃	
1. 1	.5 lb1.76	CH(CH₃)	1	0	NCH₃	
•	b1.77	CH(C₂H₅)	· _	:O	NCH <sub>3</sub>	
1.	lb1:78	CH[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]		:O	NCH₃	
	lb1.79	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1	O	NCH₃	
	1b1.80	CCH <sub>3</sub> (C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	=0		NCH₃ NCH₃	i
•	151.81	CCH <sub>3</sub> [CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ]		<u>.</u> 0	CH <sub>2</sub>	
	101.02	0	COOCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>	
	Ib1.83	0	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>	
•	lb1.84	0	CONHCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>	•
	lb1.85	0	CONICH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub>	
. 9	161.86 5 161.87	0	CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> CON(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub>	:   •
	101.07	0	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub>	
	161.88 161.89	0	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Н	CH <sub>2</sub>	
	161.89 161.90	0	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub>	
	151.90 151.91	Ö	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Н	CH <sub>2</sub>	•
<b>3</b>	o 151.92	ŏ	CH <sub>2</sub> CN	Н	CH <sub>2</sub>	٠.
	Ib1.93	Ö	CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH₂	
	1b1.94	0	CH <sub>2</sub> ON=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub>	
	1b1.95	0	CH(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH <sub>2</sub>	
	151.96	0	CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH₂	
<del>3</del>	5 Ib1.97	0	CH <sub>8</sub>	CH₃	CH <sub>2</sub>	
	1b1.98	0	CH₃	C₂H₅	CH <sub>2</sub>	
	lb1.99	0	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub>	•
	lb1.100	0	-(C	H <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> —	CH₂	
	<b>Т</b> Б1.101	. 0		O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	CH <sub>2</sub>	
4	o lb1.102		H(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH		<b>—</b>	
	161.103	0	Н	-(CH <sub>2</sub> )₄-Cl		
÷	151.104	0	CH₃	Н	CHCH₃	
	Ib1.105	0	н	- Н	CH₂ O	· -
•	Б1.106	S		0	8	
4	5 161.107	CH₂		:S	8	
	161.108	CH(CH <sub>3</sub> )		:S	8	
	161.109	CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )		· S .		

	BASP Akt	iengesellschaf	et 960970	O.Z. 0050/	47679
			31	• • • • •	•••••
•	Nr.	X	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	
	161.110	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	=5		S
	161.111	0		≈O	NH
. *	5 Ib1.112	0		=0	NCH <sub>3</sub>
	161.113	0	CH <sub>3</sub>	H	NH
	Ib1.174	O	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	NH
	161.115	0	CH <sub>3</sub>	CH₃	NH
	161.116	0	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NH
10	10 161.117	0	CH <sub>3</sub>	Н	NCH <sub>3</sub>
	161.118	0	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	NCH <sub>3</sub>
	161.119	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>
	161.120	0	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NCH <sub>3</sub>
	ъ1.121	NH .	=0		NH
15	161 122	NH	=0		NCH <sub>3</sub>
	15 прт. 123	NCH <sub>3</sub>	<b>=O</b>		NH
	161.124	NCH <sub>3</sub>	=0		NCH <sub>3</sub>
	161.125	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	=0		NH
	151.126	NC₂H₅	=0		NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

Desweiteren sind folgende 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I insbesondere außerordentlich bevorzugt:

25



35

960970

32

die Verbindungen Ib2.1-Ib2.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Nitro steht.

5

15

20

25

10

die Verbindungen Ib3.1-Ib3.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl und  $R^2$  für Methylsulfonyl stehen.

\_ \_\_\_\_

lb3

die Verbindungen Ib4.1-Ib4.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Wasserstoff und  $R^2$  für Methylsulfonyl stehen.

30

lb4

die Verbindungen Ib5.1-Ib5.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Trifluormethyl und R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl stehen.

40

die Verbindungen Ib6.1-Ib6.126, die sich von den entsprechen den Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl steht.

960970



H<sub>3</sub>C O SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> N-X R<sup>4</sup>

lb6

die Verbindungen Ib7.1-Ib7.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Nitro steht.

10

15

lb7

die Verbindungen Ib8.1-Ib8.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^2$  für Trifluormethyl steht.

25

20

**Ib8** 

die Verbindungen Ib9.1-Ib9.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^2$  für Methylthio steht.

30

lb9

die Verbindungen Ib10.1-Ib10.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R² für Methylsulfinyl steht.

960970



**lb10** 

die Verbindungen Ibl1.1-Ib11.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Trifluormethylsulfonyl steht.

10

lb11

20

15

die Verbindungen Ib12.1-Ib12.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methoxy und  $R^2$  für Methylsulfonyl stehen.

25

**lb12** 

30

die Verbindungen Ib13.1-Ib13.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Ethylsulfonyl steht.

lb13

die Verbindungen Ib14.1-Ib14.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Methylsulfonyl und  $R^3$  für Methyl stehen.

960970

35

**lb14** 

die Verbindungen Ib15.1-Ib15.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl und R<sup>3</sup> für Chlor stehen.

10

15

5

$$H_3C$$
 $O$ 
 $CI$ 
 $N$ 
 $N$ 
 $OH$ 
 $CI$ 
 $SO_2CH_3$ 

lb15

20

die Verbindungen Ib16.1-Ib16.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  Methyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl und  $R^3$  für Chlor stehen.

, 25

lb16

30

die Verbindungen Ibl7.1-Ibl7.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  Methyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl und  $R^3$  für Methyl stehen.

35

lb17

die Verbindungen Ib18.1-Ib18.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R¹ für Methyl steht.

960970

36

lb18

die Verbindungen Ib19.1-Ib19.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^1$  für Methyl und  $\mathbb{R}^2$  für Wasserstoff stehen.

H<sub>3</sub>C CH<sub>3</sub> N Y

ČH<sub>2</sub>

lb19

15

5

10

die Verbindungen Ib20.1-Ib20.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^1$  für Methyl und  $\mathbb{R}^2$  für Nitro stehen.

25

20

**lb20** 

30

die Verbindungen Ib21.1-Ib21.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^2$  für Methylsulfonyl und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

\_\_

40

die Verbindungen Ib22.1-Ib22.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^2$  für Nitro und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

960970

37

lb22

die Verbindungen Ib23.1-Ib23.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^1$  für Methyl,  $\mathbb{R}^2$  für Methylsulfonyl und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

15

10

lb23

- die Verbindungen Ib24.1-Ib24.126, die sich von den entspre20 chenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
R¹ für Wasserstoff, R² für Methylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

25

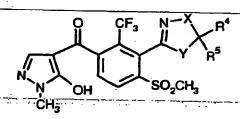
30

45

**lb24** 

die Verbindungen Ib25.1-Ib25.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^1$  für Trifluormethyl,  $\mathbb{R}^2$  für Methylsulfonyl und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

\_



1b25

die Verbindungen Ib26.1-Ib26.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

**lb26** 

38

die Verbindungen Ib27.1-Ib27.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Nitro und R18 für Wasserstoff stehen.

10

15

**lb27** 

die Verbindungen Ib28.1-Ib28.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß 20  $R^2$  für Trifluormethyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

25

30

**lb28** 

die Verbindungen Ib29.1-Ib29.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Methylthio und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

CH<sub>3</sub>

lb29

die Verbindungen Ib30.1-Ib30.126, die sich von den entspre-40 chenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfinyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

39

1b30

die Verbindungen Ib31.1-Ib31.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß  ${\tt R}^2$  für Trifluormethylsulfonyl und  ${\tt R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

**lb31** 

15

2.0

10

die Verbindungen Ib32.1-Ib32.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Methoxy, R2 für Methylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

25

30 -

die Verbindungen Ib33.1-Ib33.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Ethylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

1b33

-die-Verbindungen Ib34.1-Ib34.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Methylsulfonyl, R3 für Methyl und R18 für Wasserstoff stehen.

960970



4(

die Verbindungen Ib35.1-Ib35.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden,daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>3</sup> für Chlor und R<sup>18</sup> für Wasserstoff

lb35



10

stehen.

O CI N-X R<sup>4</sup>
N OH CI SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

- die Verbindungen Ib36.1-Ib36.126, die sich von den entspre-20 chenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>3</sup> für Chlor und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

lb36

<del>1b37</del>

25

40

45

die Verbindungen Ib37.1-Ib37.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  Methyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^3$  für Methyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.



O CH<sub>3</sub> N R<sup>5</sup>
N OH CH<sub>3</sub> SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

die Verbindungen Ib38.1-Ib38.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970



41

**Ib38** 

die Verbindungen Ib39.1-Ib39.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  ${\tt R^1}$  für Methyl,  ${\tt R^2}$  für Wasserstoff und  ${\tt R^{18}}$  für Wasserstoff stehen.

15

10

1b39

20

die Verbindungen Ib40.1-Ib40.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^1$  für Methyl,  $\mathbb{R}^2$  für Nitro und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

25

lb40

30 -

die Verbindungen Ib41.1-Ib41.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Nitro,  $R^{16}$  für Ethyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

lb41

40 - die Verbindungen Ib42.1-Ib42.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

1b42

42

die Verbindungen Ib43.1-Ib43.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^1$  für Wasserstoff,  $\mathbb{R}^2$  für Methylsulfonyl,  $\mathbb{R}^{16}$  für Ethyl und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

lb43

15

10

- die Verbindungen Ib44.1-Ib44.126, die sich von den entspre20 chenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
R¹ für Trifluormethyl, R² für Methylsulfonyl, R¹6 für Ethyl
und R¹8 für Wasserstoff stehen.

- Ib44

25

30

die Verbindungen Ib45.1-Ib45.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  ${\bf R^1}$  für Methylsulfonyl,  ${\bf R^{16}}$  für Ethyl und  ${\bf R^{18}}$  für Wasserstoff stehen.

•

die Verbindungen Ib46.1-Ib46.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Nitro, R<sup>16</sup> für Ethyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

45

960970

**Ib46** 

die Verbindungen Ib47.1-Ib47.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Trifluormethyl, R<sup>16</sup> für Ethyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff . stehen.

15

10

**Ib47** 

20

die Verbindungen Ib48.1-Ib48.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  ${\it R}^{2}$  für Methylthio,  ${\it R}^{16}$  für Ethyl und  ${\it R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

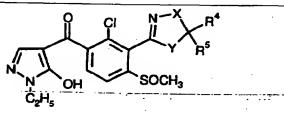
25

**lb48** 

die Verbindungen Ib49.1-Ib49.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Methylsulfinyl, R16 für Ethyl und R18 für Wasserstoff stehen.

40

30



**1**649

die Verbindungen Ib50.1-Ib50.126, die sich von den entsprechenden-Verbindungen-Ib1.1-Ib1.126-dadurch\_unterscheiden,\_da8\_ R2 für Trifluormethylsulfonyl, R16 für Ethyl und R18 für Was-45 serstoff stehen.

960970

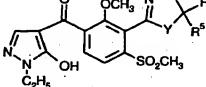
44

lb50

die Verbindungen Ib51.1-Ib51.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methoxy, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

O OCH3 N-X

lb51



20

15

10

die Verbindungen Ib52.1-Ib52.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Ethylsulfonyl,  $R^{16}$  für Ethyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

25

lb52



die Verbindungen Ib53.1-Ib53.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^3$  für Methyl,  $R^{16}$  für Ethyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

40

45

1b53

die Verbindungen Ib54.1-Ib54.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>3</sup> für Chlor, R<sup>16</sup> für Ethyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

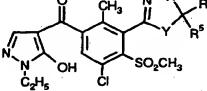
960970



45

die Verbindungen Ib55.1-Ib55.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 Methyl, R2 für Methylsulfonyl, R3 für Chlor, R16 für Ethyl und R18 für Wasserstoff stehen.

1b55



20

10

die Verbindungen Ib56.1-Ib56.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  Methyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^3$  für Methyl,  $R^{16}$  für Ethyl und R18 für Wasserstoff stehen.

25

lb56

30

die Verbindungen Ib57.1-Ib57.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^{16}$  für Ethyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

die Verbindungen Ib58.1-Ib58.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Wasserstoff, R<sup>16</sup> für Ethyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

45

960970

46

**lb58** 

die Verbindungen Ib59.1-Ib59.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^2$  für Nitro,  $R^{16}$  für Ethyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

lb59

15

10

\_ 20

die Verbindungen Ib61.1-Ib61.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für n-Propyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

lb60

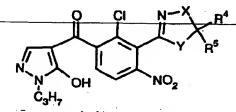
N OH SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

30

25

die Verbindungen Ib61.1-Ib61.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Nitro,  $R^{16}$  für n-Propyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35



lb61

..40 . .

die Verbindungen Ib62.1-Ib62.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹-für Methyl, R²-für Methylsulfonyl, R¹-für n-Propyl und R¹-für Wasserstoff stehen.

45

960970

**lb62** 

die Verbindungen Ib63.1-Ib63.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Wasserstoff, R² für Methylsulfonyl, R¹6 für n-Propyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

1b63



N OH SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

die Verbindungen Ib64.1-Ib64.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Trifluormethyl, R² für Methylsulfonyl, R¹6 für n-Propyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

25

10

O CF<sub>3</sub> N-X R<sup>4</sup>
Y R<sup>5</sup>
SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

**1b64** 

die Verbindungen Ib65.1-Ib65.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für n-Propyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

45

die Verbindungen Ib66.1-Ib66.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^1$  für Nitro,  $\mathbb{R}^{16}$  für n-Propyl und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

960970

1b66

die Verbindungen Ib67.1-Ib67.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Trifluormethyl, R16 für n-Propyl und R18 für Wasserstoff stehen.

10

15

5

**Ib67** 

20

die Verbindungen Ib68.1-Ib68.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylthio, R<sup>16</sup> für n-Propyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

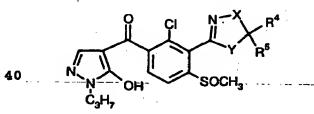
25

1b68

30

die Verbindungen Ib69.1-Ib69.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Methylsulfinyl, R16 für n-Propyl und R18 für Wasserstoff stehen.

**1b69** 



die Verbindungen Ib70.1-Ib70-126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß 45 R2 für Trifluormethylsulfonyl, R16 für n-Propyl und R18 für Wasserstoff stehen.

960970

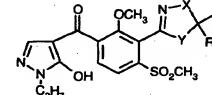
49

lb70

die Verbindungen Ib71.1-Ib71.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methoxy, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für n-Propyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

10

15



lb71

20

die Verbindungen Ib72.1-Ib72.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Ethylsulfonyl, R<sup>16</sup> für n-Propyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

25

lb72

30

die Verbindungen Ib73.1-Ib73.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^3$  für Methyl,  $R^{16}$  für n-Propyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

40

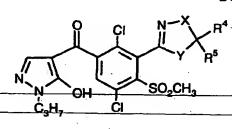
45

die Verbindungen Ib74.1-Ib74.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>3</sup> für Chlor, R<sup>16</sup> für n-Propyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

50

**lb74** 



die Verbindungen Ib75.1-Ib75.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>1</sup> Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>3</sup> für Chlor, R<sup>16</sup> für n-Propyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

lb75

15

N OH CI SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

die Verbindungen Ib76.1-Ib76.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ Methyl, R² für Methylsulfonyl, R³ für Methyl, R¹6 für n-Propyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

25

Ib76

30

die Verbindungen Ib77.1-Ib77.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^{16}$  für n-Propyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

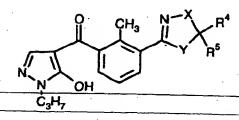
40

die Verbindungen Ib78.1-Ib78.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Wasserstoff, R¹6 für n-Propyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

960970

51

1b78



die Verbindungen Ib79.1-Ib79.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Nitro, R<sup>16</sup> für n-Propyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

lb79

15:

5

10

O CH<sub>3</sub> N-X R<sup>4</sup>
NO<sub>2</sub> OH NO<sub>2</sub>

die Verbindungen Ib80.1-Ib80.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^{16}$  für n-Propyl und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

N N OH CI

**Ib80** 

30 \_

die Verbindungen Ib81.1-Ib81.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für n-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

25

40

die Verbindungen Ib82.1-Ib82.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Nitro, R<sup>16</sup> für n-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

45

960970

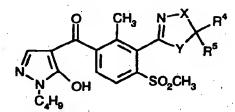


52

**lb82** 

die Verbindungen Ib83.1-Ib83.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für n-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

.



**Ib83** 

20

15

5

10

die Verbindungen Ib84.1-Ib84.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Wasserstoff,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für n-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

25

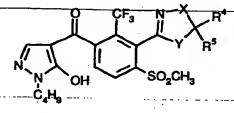
30

**Ib84** 

die Verbindungen Ib85.1-Ib85.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Trifluormethyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für n-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

45



Jb85

die Verbindungen Ib86.1-Ib86.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für n-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

53

**Ib86** 

die Verbindungen Ib87.1-Ib87.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Nitro, R<sup>16</sup> für n-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

O NO<sub>2</sub> N-X R<sup>4</sup>

1b87

**1**b88

15 N N OH CI

- die Verbindungen Ib88.1-Ib88.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Trifluormethyl, R<sup>16</sup> für n-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

:

10

N OH CF3

Ċ.H.

stehen.

die Verbindungen Ib89.1-Ib89.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Methylthio,  $R^{16}$  für n-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff

35

30. -

.40.

45

die Verbindungen Ib90.1-Ib90.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfinyl, R<sup>16</sup> für n-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970



54

**Ib90** 

die Verbindungen Ib91.1-Ib91.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Trifluormethylsulfonyl, R16 für n-Butyl und R18 für Wasserstoff stehen.

**Ib91** 

20

10

15

die Verbindungen Ib92.1-Ib92.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Methoxy, R2 für Methylsulfonyl, R16 für n-Butyl und R18 für Wasserstoff stehen.

25

**lb92** 

30

die Verbindungen Ib93.1-Ib93.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Ethylsulfonyl, R16 für n-Butyl und R18 für Wasserstoff stehen.

35

40

die Verbindungen Ib94.1-Ib94.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^3$  für Methyl,  $R^{16}$  für n-Butyl und  $R^{18}$ für Wasserstoff stehen.

960970

55

**lb94** 

die Verbindungen Ib95.1·Ib95.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>3</sup> für Chlor, R<sup>16</sup> für n-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

1b95

15

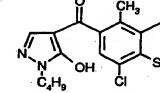
10

N OH CI SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

die Verbindungen Ib96.1-Ib96.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R³ für Chlor, R¹6 für n-Butyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

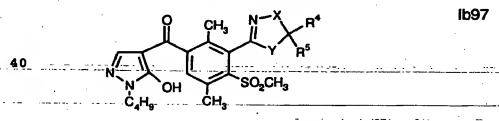
25

1b96



die Verbindungen Ib97.1Ib97.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^3$  für Methyl,  $R^{16}$  für

n-Butyl und R18 für Wasserstoff stehen.



die Verbindungen Ib98.1-Ib98.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>16</sup> für n-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.



960970

56

**Ib98** 

die Verbindungen Ib99.1-Ib99.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Wasserstoff, R¹6 für n-Butyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

15

20

10

lb99

die Verbindungen Ib100.1-Ib100.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^2$  für Nitro,  $R^{16}$  für n-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

25

lb100

30

die Verbindungen Ib101.1-Ib101.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^{16}$  für n-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

45

טרמו

die Verbindungen Ib102.1-Ib102.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch—unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für iso-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

57

lb102

die Verbindungen Ib103.1-Ib103.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Nitro, R16 für iso-Butyl und R18 für Wasserstoff stehen.

15

10

lb103

20

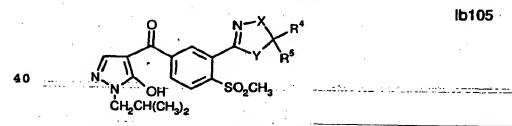
die Verbindungen Ib104.1-Ib104.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für iso-Butyl und  $R^{18}$ für Wasserstoff stehen.

lb104

25

30

die Verbindungen Ib105.1-Ib105.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Wasserstoff, R2 für Methylsulfonyl, R16 für iso-Butyl und R18 für Wasserstoff stehen.



45

die Verbindungen Ib106.1-Ib106.126, die -sich-von-den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Trifluormethyl, R2 für Methylsulfonyl, R16 für iso-Butyl und R18 für Wasserstoff stehen.

960970

58

lb106

die Verbindungen Ib107.1-Ib107.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R¹6 für iso-Butyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

10

15

lb107

die Verbindungen Ib108.1-Ib108.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R¹6 für iso-Butyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

25

20

lb108

30

die Verbindungen Ib109.1-Ib109.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Trifluormethyl,  $R^{16}$  für iso-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

2.5

lb109

die Verbindungen Ib110.1-Ib110.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>2</sup> für Methylthio, R<sup>16</sup> für iso-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

59

lb110

die Verbindungen Ib111.1-Ib111.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfinyl, R<sup>16</sup> für iso-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

lb111

15

10

OH SOCH<sub>3</sub>

20 - die Verbindungen Ib112.1-Ib112.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Trifluormethylsulfonyl, R¹6 für iso-Butyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

25

30

die Verbindungen Ib113.1-Ib113.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methoxy,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für iso-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

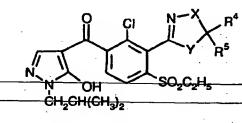
die Verbindungen Ib114.1-Ib114.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>2</sup> für Ethylsulfonyl, R<sup>16</sup> für iso-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

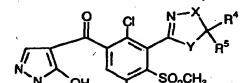


60

lb114



die Verbindungen Ib115.1-Ib115.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^3$  für Methyl,  $R^{16}$  für iso-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.



CH2CH(CH2), CH3

lb115

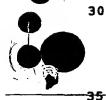


die Verbindungen Ib116.1-Ib116.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>3</sup> für Chlor, R<sup>16</sup> für iso-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

25

10

lb116



die Verbindungen Ib117.1-Ib117.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>3</sup> für Chlor, R<sup>16</sup> für iso-Butyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

40

45

1011*/* 

960970

61

- die Verbindungen Ib118.1-Ib118.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, R³ für Methyl, R¹6 für iso-Butyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

10 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> N-X R
SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>
CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>

lb118

die Verbindungen Ib119.1-Ib119.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^{16}$  für iso-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

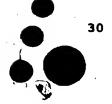
lb119

25

20

15

die Verbindungen Ib120.1-Ib120.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^2$  für Wasserstoff,  $R^{16}$  für iso-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.



O CH<sub>3</sub> N-X R<sup>4</sup> Ib120

serstoff stehen.

- ------

die Verbindungen Ib121.1-Ib121.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹-für-Methyl, R² für Nitro, R¹6 für iso-Butyl und R¹8 für Was-

960970

6:

lb121

die Verbindungen Ib122.1-Ib122.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^{16}$  für iso-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

CI N-X PA

lb122

10

15

20

25

N OH CI CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

die Verbindungen Ib123.1-Ib123.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methylsulfonyl und R<sup>2</sup> für Trifluormethyl stehen.

H<sub>3</sub>C O SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> N-X R<sup>4</sup>
CF<sub>3</sub> OH

lb123

30

die Verbindungen Ib124.1-Ib124.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>2</sup> für Trifluormethyl, und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.



O SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> N-X R<sup>4</sup>
V R<sup>5</sup>
CH<sub>3</sub> OH

lb124

die Verbindungen Ib125.1-Ib125.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R² für Trifluormethyl, R¹6 für n-Propyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.



960970

63

lb125

die Verbindungen Ib126.1-Ib126.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methylsulfonyl,  $R^2$  für Trifluormethyl,  $R^{16}$  für n-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

15

10

SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>N-X R<sup>5</sup> lb126

20

die Verbindungen Ib127.1-Ib127.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methylsulfonyl,  $R^2$  für Trifluormethyl,  $R^{16}$  für iso-Butyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

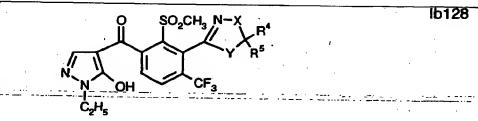
25

30

lb127

die Verbindungen Ib128.1-Ib128.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methylsulfonyl,  $R^2$  für Trifluormethyl,  $R^{16}$  für Ethyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

25



die Verbindungen Ib129.1-Ib129.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R¹ für Nitro und R² für Methylsulfonyl stehen.

960970

64 CH<sub>2</sub>

die Verbindungen Ib130.1-Ib130.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Nitro,  $R^2$  für Methylsulfonyl, und  $R^{18}$  für Wasserstoff

10 stehen.

lb130

lb129

20

15

die Verbindungen Ib131.1-Ib131.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Nitro, R2 für Methylsulfonyl, R16 für n-Propyl und R18 für Wasserstoff stehen.

25

lb131

die Verbindungen Ib132.1-Ib132.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Nitro, R2 für Methylsulfonyl, R16 für n-Butyl und R18 für Wasserstoff stehen.

40

45

<del>1b132</del>

die Verbindungen Ib133.1-Ib133.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Nitro, R2 für Methylsulfonyl, R16 für iso-Butyl und R18 für Wasserstoff stehen.

960970

65

lb133

die Verbindungen Ib134.1-Ib134.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Nitro, R2 für Methylsulfonyl, R16 für Ethyl und R18 für Wasserstoff stehen.

lb134

15

die Verbindungen Ib135.1-Ib135.126, die sich von den entspre-20 chenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R18 für Wasserstoff steht.

25

30

10

die Verbindungen Ib136.1-Ib136.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R16 für Ethyl und R18 für Wasserstoff stehen.

lb136

die Verbindungen Ib137.1-Ib137.126die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch-unterscheiden, daß Z für Methylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

960970

lb137

die Verbindungen Ib138.1-Ib138.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Methylsulfonyl , Z für Methylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

15

10

lb138

20 - die Verbindungen Ib139.1-Ib139.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Nitro, Z für Methylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

25 -

lb139



die Verbindungen Ib140.1-Ib140.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^1$  für Methyl,  $\mathbb{R}^2$  für Methylsulfonyl , Z für Methylsulfonyl und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

40

die Verbindungen Ib141.1-Ib141.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl , Z für Methylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

960970

67

lb141

die Verbindungen Ib142.1·Ib142.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^1$  für Nitro, Z für Methylsulfonyl und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

10

15

lb142

die Verbindungen Ib143.1-Ib143.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² und Z für Methylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

25

Ib143-

30

die Verbindungen Ib144.1-Ib144.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Ethylsulfonyl, Z für Methylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

45

lb144

die Verbindungen Ib145.1-Ib145.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970



68

lb145

die Verbindungen Ib146.1-Ib146.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

lb146

15

10

die Verbindungen Ib147.1-Ib147.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, R¹6 für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

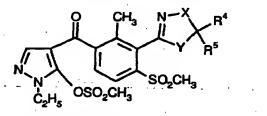
25

lb147

30

die Verbindungen Ib148.1-Ib148.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35



**Ib148** 

die Verbindungen Ib149.1-Ib149.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R¹ für Methylsulfonyl, R¹6 für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

960970

lb149

die Verbindungen Ib150.1-Ib150.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Nitro, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

lb150

die Verbindungen Ib151.1-Ib151.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, R¹6 für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

25

10

15

lb151

30

die Verbindungen Ib152.1-Ib152.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Ethylsulfonyl,  $R^{16}$  für Ethyl, Z für Methylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

1b152

die Verbindungen Ib153.1-Ib153.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch-unterscheiden, daß Z für Methylsulfonyl steht.

45

960970

H<sub>3</sub>C CI N R<sup>5</sup>
R<sup>5</sup>
CH<sub>3</sub> OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

die Verbindungen Ib154.1-Ib154.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> und Z für Methylsulfonyl stehen.

H<sub>3</sub>C CI N-X R<sup>5</sup>
SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

lb154

lb153

20

25

15

10

die Verbindungen Ib155.1-Ib155.126, die sich von den entsprechenden Ver-bindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Nitro und Z für Methylsulfonyl stehen.

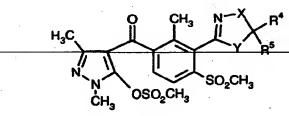
H<sub>3</sub>C CI N R<sup>4</sup>
N N N NO<sub>2</sub>
CH<sub>3</sub> OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

lb155

30

45

die Verbindungen Ib156.1-Ib156.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^1$  für Methyl,  $\mathbb{R}^2$  und Z für Methylsulfonyl stehen.



lb156

die Verbindungen Ib157.1-Ib157.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
R¹ und Z für Methylsulfonyl stehen.

960970

die Verbindungen Ib158.1-Ib158.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Nitro und Z für Methylsulfonyl stehen.

lb158

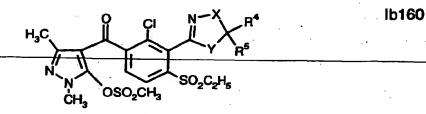
lb157

die Verbindungen Ib159.1-Ib159.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methoxy,  $R^2$  und Z für Methylsulfonyl stehen.

H<sub>3</sub>C OCH<sub>3</sub> N R<sup>4</sup>
N N SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>
CH<sub>3</sub> OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

lb159

- die Verbindungen Ib160.1-Ib160.126, die sich von den entspre30 chenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
R<sup>2</sup> für Ethylsulfonyl und Z für Methylsulfonyl stehen.



die Verbindungen Ib161.1-Ib161.126, die sich von den entspre chenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126-dadurch unterscheiden, daß
 z für Ethylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

10

15

20

25

960970



72

**Ib161** 

die Verbindungen Ib162.1-Ib162.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

lb162

15

10

die Verbindungen Ib163.1-Ib163.126, die sich von den entspre-20 chenden Ver-bindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Nitro, Z für Ethylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

25

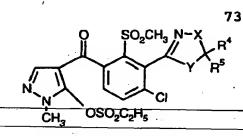
lb163

die Verbindungen Ib164.1-Ib164.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Methyl, R2 für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

die Verbindungen Ib165.1-Ib165.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß 45 R1 für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.



960970



lb165

die Verbindungen Ib166.1-Ib166.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Nitro, Z für Ethylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

15

10

lb166

die Verbindungen Ib167.1-Ib167.126, die sich von den entspre-20 chenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Methoxy, R2 für Methylsulfonyl, Z für Ethylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

25

30

die Verbindungen Ib168.1-Ib168.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  ${\tt R^2}$  und Z für Ethylsulfonyl und  ${\tt R^{18}}$  für Wasserstoff stehen.



lb168

40

die Verbindungen Ib169.1-Ib169.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R16 für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

45

960970

74

lb169

die Verbindungen Ib170.1-Ib170.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

lb170



OSO<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

20 - die Verbindungen Ib171.1-Ib171.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, R¹6 für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

25

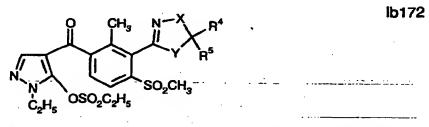
10

lb171



die Verbindungen Ib172.1-Ib172.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

40



die Verbindungen Ib173.1-Ib173.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, R¹6 für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

960970

75

lb173

die Verbindungen Ib174.1·Ib174.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, R¹6 für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

lb174

15

10

20 - die Verbindungen Ib175.1-Ib175.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methoxy, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

25

30

lb175



die Verbindungen Ib176.1-Ib176.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^2$  für Ethylsulfonyl,  $\mathbb{R}^{16}$  für Ethyl, Z für Ethylsulfonyl und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

45

960970

O.Z. 0050/47679

76

die Verbindungen Ib177.1-Ib177.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Ethylsulfonyl steht.

H<sub>3</sub>C CI N-X R<sup>4</sup>

N N OSO<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

lb177

die Verbindungen Ib178.1-Ib178.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^2$  für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.

15

20

10

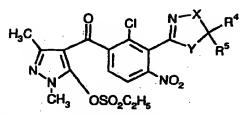
lb178.

H<sub>3</sub>C CI N-X R<sup>5</sup>
SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>
CH<sub>3</sub> OSO<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

- die Verbindungen Ib179.1-Ib179.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Nitro und Z für Ethylsulfonyl stehen.

30

lb179



die Verbindungen Ib180.1-Ib180.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.

40

960970

O.Z. 0050/47679

lb181



77

die Verbindungen Ib181.1-Ib181.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R¹ für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.

 die Verbindungen Ib182.1-Ib182.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>1</sup> für Nitro und Z für Ethylsulfonyl stehen.

15

20

25

30

lb182

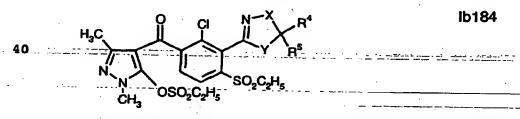
die Verbindungen Ib183.1-Ib183.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl und Z für Ethylsulfonyl stehen.



H<sub>3</sub>C OCH<sub>3</sub> N R<sup>5</sup>
N OSO<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

lb183

die Verbindungen Ib184.1-Ib184.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R² und Z für Ethylsulfonyl stehen.



die Verbindungen Ib185.1-Ib185.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für iso-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

78

O.Z. 0050/47679

lb185

die Verbindungen Ib186.1-Ib186.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R <sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

15

10

**Ib186** 

die Verbindungen Ib187.1-Ib187.126, die sich von den entsprechenden Ver-bindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Nitro, Z für iso-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

25

20

**Ib187** 

30

die Verbindungen Ib188.1-Ib188.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

\_\_\_\_\_

lb188

die Verbindungen Ib189.1-Ib189.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>1</sup> für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

10

15

25

30

45

BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679

79

SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>N-X
R<sup>4</sup>

CH<sub>3</sub> OSO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

die Verbindungen Ib190.1-Ib190.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

NN OSO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

Ib190

die Verbindungen Ib191.1-Ib191.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

OCH<sub>3</sub> N-X R<sup>4</sup>
NN OSO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

Ib191

die Verbindungen Ib192.1-Ib192.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Ethylsulfonyl, Z für iso-Propylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

Ib192

CI N-X R<sup>4</sup>

SO<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

CH<sub>3</sub> OSO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

die Verbindungen Ib193.1-Ib193.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen. 15

25

30

BASF Aktiengesellschaft 960970 0.Z. 0050/47679

80

| Description of the content of the content

die Verbindungen Ib194.1-Ib194.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R <sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

N N SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>
C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> OSO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

20 - die Verbindungen Ib195.1-Ib195.126, die sich von den entsprechenden Ver-bindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, R¹6 für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

NNN OSO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

die Verbindungen Ib196.1-Ib196.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

40 CH<sub>3</sub> N-X R<sup>4</sup>
SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>
C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> OSO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

die Verbindungen Ib197.1-Ib197.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>1</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

O.Z. 0050/47679



81

lb197

die Verbindungen Ib198.1-Ib198.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Nitro, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

15

10

lb198

20

die Verbindungen Ib199.1-Ib199.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methoxy,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für Ethyl, für isopropylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

25

lb199

30 \_

die Verbindungen Ib200.1-Ib200.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Ethylsulfonyl,  $R^{16}$  für Ethyl, Z für iso-Propylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

lb200

die Verbindungen Ib201.1-Ib201.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126-dadurch-unterscheiden, daß Z für n-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

45

960970

O.Z. 0050/47679



82

**Ib201** 

die Verbindungen Ib202.1-Ib202.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

15

10

lb202

20

die Verbindungen Ib203.1-Ib203.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Nitro, Z für n-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

25

lb203

30

die Verbindungen Ib204.1-Ib204.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Methyl, R2 für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

40

die Verbindungen Ib205.1-Ib205.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

960970

o.z. 0050/47679

83

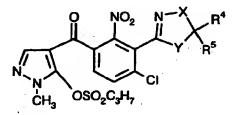
lb205

die Verbindungen Ib206.1-Ib206.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Nitro, Z für n-Propylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

Ib206

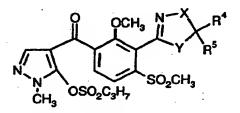
15

10



die Verbindungen Ib207.1·Ib207.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1·Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methoxy, R² für Methylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

25

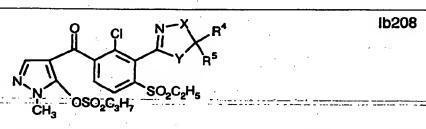


lb207

30

die Verbindungen Ib.208.1-Ib208.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden. daß R<sup>2</sup> für Ethylsulfonyl, Z für n-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

35



die Verbindungen Ib209.1-Ib209.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

O.Z. 0050/47679



84

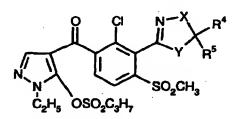
lb209

die Verbindungen Ib210.1-Ib210.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

lb210

15

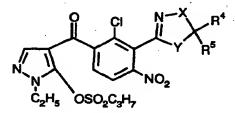
10



20 - die Verbindungen Ib211.1-211.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, R¹6 für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

25

30

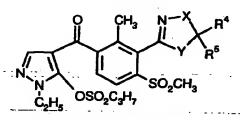


lb211

die Verbindungen Ib212.1-Ib212.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

40

45



10212

die Verbindungen Ib213.1-Ib213.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

O.Z. 0050/47679



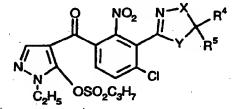
85

lb213

die Verbindungen Ib214.1-Ib214.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Nitro,  $R^{16}$  für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

15

10



lb214

die Verbindungen Ib215.1-Ib215.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methoxy, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für n-propylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

25

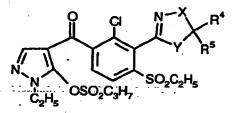
lb215

die Verbindungen Ib216.1-Ib216.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Ethylsulfonyl,  $R^{16}$  für Ethyl, Z für n-Propylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

45

30



lb216

die Verbindungen Ib217.1-Ib217.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für n-Butylsulfonyl und R<sup>16</sup> für Wasserstoff stehen. 10

25

30

BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679

86

| b217

die Verbindungen Ib218.1-Ib218.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R <sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

Ib218

O CI N-X
R<sup>4</sup>

SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

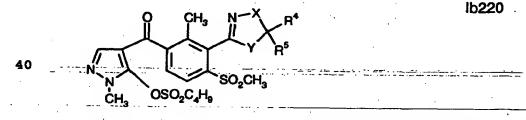
SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

20 - die Verbindungen Ib219.1-Ib219.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, Z für n-Butylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

Ib 219

NN
NO
CH<sub>3</sub>
OSO<sub>2</sub>C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>

die Verbindungen Ib220.1-Ib220.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.



die Verbindungen Ib221.1-Ib221.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

960970

O.Z. 0.050/47679



87

lb221

die Verbindungen Ib222.1-Ib222.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Nitro, Z für n-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

lb222



N N OSO<sub>2</sub>C<sub>4</sub>H<sub>8</sub>

die Verbindungen Ib223.1-Ib223.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methoxy, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

lb223

25

10

die Verbindungen Ib224.1-Ib224.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Ethylsulfonyl, Z für n-Butylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

die Verbindungen Ib225.1-Ib225.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.



960970

88

lb225

die Verbindungen Ib226.1-Ib226.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

lb226

15

OSO,C,H,

die Verbindungen Ib227.1-Ib227.126, die sich von den entspre-20 chenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß  $\mathbb{R}^2$  für Nitro,  $\mathbb{R}^{16}$  für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und  $\mathbb{R}^{18}$  für Wasserstoff stehen.

lb227

25

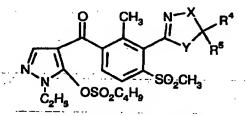
10

30

die Verbindungen Ib228.1-Ib228.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Methyl, R2 für Methylsulfonyl, R16 für Ethyl, Z für n-Rutylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

lb228

40



die Verbindungen Ib229.1-Ib229.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß 45 R1 für Methylsulfonyl, R16 für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

960970

o.z. 0050/476

lb229

die Verbindungen Ib230.1-Ib230.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R1 für Nitro, R16 für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

lb230



OSO<sub>2</sub>C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>

die Verbindungen Ib231.1-Ib231.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß 20  $\mathbb{R}^1$  für Methoxy,  $\mathbb{R}^2$  für Methylsulfonyl,  $\mathbb{R}^{16}$  für Ethyl,  $\mathbb{Z}$  für n-Butylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

lb231

25

30

10

die Verbindungen Ib232.1-Ib232.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Ethylsulfonyl, R16 für Ethyl, Z für n-Butylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.



lb232

die Verbindungen Ib233.1-Ib233.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß 45 Z für iso-Butylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

<u>OSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH(ČH</u>2

15

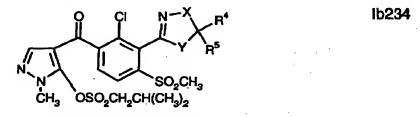
25

30

40

## BASF Aktiengesellschaft 960970 0.Z. 0050,

die Verbindungen Ib234.1-Ib234.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.



die Verbindungen Ib235.1-Ib235.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R² für Nitro, Z für iso-Butylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

die Verbindungen Ib236.1-Ib236.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

die Verbindungen Ib237.1-Ib237.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>1</sup> für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

O.Z. 0050/47679

91

lb237

die Verbindungen Ib238.1-Ib238.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Nitro, Z für iso-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

.

10

15

**lb238** 

die Verbindungen Ib239.1-Ib239.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methoxy, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

25

30

lb239

die Verbindungen Ib240.1-Ib240.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Ethylsulfonyl, Z für iso-Butylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35

.

45

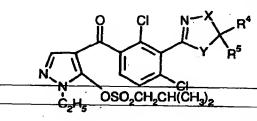
die Verbindungen Ib241.1-Ib241.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl-und-R<sup>18</sup>-für Wasserstoff stehen.

960970

O.Z. 0050/47679

92

lb241



die Verbindungen Ib242.1-Ib242.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

15

10

lb242

die Verbindungen Ib243.1-Ib243.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Nitro, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

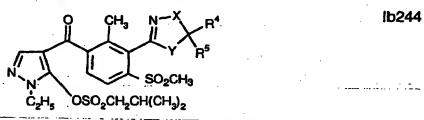
25

**Ib243** 

30

die Verbindungen Ib244.1-Ib244.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

35



die Verbindungen Ib245.1-Ib245.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
R¹ für Methylsulfonyl, R¹6 für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl
und R¹8 für Wasserstoff stehen.

960970

O.Z. 0050/47679

93

lb245

die Verbindungen Ib246.1-Ib246.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Nitro, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

10

15



lb246

20 -

die Verbindungen Ib247.1-Ib247.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methoxy,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

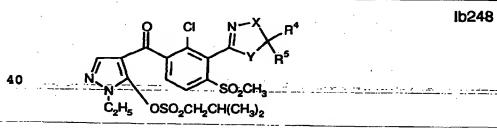
25

lb247

30

die Verbindungen Ib248.1-Ib248.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Ethylsulfonyl,  $R^{16}$  für Ethyl, Z für iso-Butylsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35



45

die Verbindungen Ib249.1-Ib249.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß Z für Phenylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

15

25

30

35

40

BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679

94

| b249

die Verbindungen Ib250.1-Ib250.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß
 R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, Z für Phenylsulfonyl und R <sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

N N SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

20 - die Verbindungen Ib251.1-Ib251.126 die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R¹ für Methyl, R² für Methylsulfonyl, Z für Phenylsulfonyl und R¹8 für Wasserstoff stehen.

Ib251

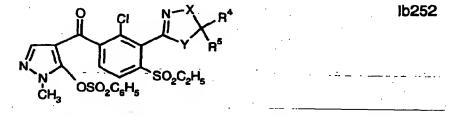
OCH<sub>3</sub> N-X
P<sup>4</sup>

NN-X
P<sup>5</sup>

SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

CH<sub>3</sub> OSO<sub>2</sub>C<sub>5</sub>H<sub>5</sub>

die Verbindungen Ib252.1-Ib252.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Ethylsulfonyl, Z für Phenylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.



die Verbindungen Ib253.1-Ib253.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

95

lb253

die Verbindungen Ib254.1-Ib254.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Methylsulfonyl, R16 für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

OSO<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>

lb254

die Verbindungen Ib255.1-Ib255.126, die sich von den entspre-20 chenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

25

lb255

30

10

15

die Verbindungen Ib256.1-Ib256.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R2 für Ethylsulfonyl, R16 für Ethyl, Z für Phenylsulfonyl und R18 für Wasserstoff stehen.

lb256

die Verbindungen Ib257.1-Ib257.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ibl.1-Ibl.126 dadurch unterscheiden, daß 45 Z für p-Toluolsulfonyl und R18 für Wasserstoff-stehen.

960970 . . 0.

O.Z. Q050/47679

96

ib257

die Verbindungen Ib258.1-Ib258.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

10

ib258

20 - die Verbindungen Ib259.1-Ib259.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>1</sup> für Methyl, R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

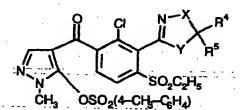
25

lb259

30

die Verbindungen Ib260.1-Ib260.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^2$  für Ethylsulfonyl, Z für p-Toluolsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

35



**Ib260** 

die Verbindungen Ib261.1-Ib261.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

960970

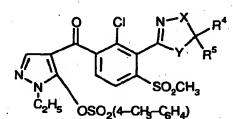
0.z. 0050/47679

97

lb261

die Verbindungen Ib262.1-Ib262.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Methylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

15

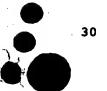


lb262

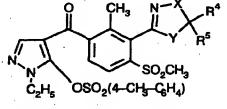
20

die Verbindungen Ib263.1-Ib263.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß  $R^1$  für Methyl,  $R^2$  für Methylsulfonyl,  $R^{16}$  für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und  $R^{18}$  für Wasserstoff stehen.

25



lb263



die Verbindungen Ib264-Ib264.126, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ib1.1-Ib1.126 dadurch unterscheiden, daß R<sup>2</sup> für Ethylsulfonyl, R<sup>16</sup> für Ethyl, Z für p-Toluolsulfonyl und R<sup>18</sup> für Wasserstoff stehen.

40

45

Ih264

o.z. 0050/47679

Die 3-Heterocyclyl-substituierten Benzolylderivate der Formel I sind auf verschiedene Art und Weise erhältlich, beispielsweise nach folgendem Verfahren:

## Verfahren A:

Umsetzung von Pyrazolen der Formel II (mit Z=H) mit einer aktivierten Benzoesäure III $\alpha$  oder einer Benzoesäure III $\beta$ , die vorzugstweise in situ aktiviert wird, zu dem Acylierungsprodukt und anschließende Umlagerung.



960970 O.Z. 0050/47679

99



R16
N OH
R16
II (mit Z = H)

960970

O.Z. 0050/47679

100

L1 steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie Halogen z.B Brom, Chlor, Hetaryl, z.B. Imidazolyl, Pyridyl, Carboxylat, z.B. Acetat, Trifluoracetat etc.

Die aktivierte Benzoesäure kann direkt eingesetzt werden, wie im Fall der Benzoylhalogenide oder in situ erzeugt werden, z.B. mit Dicyclohexylcarbodiimid, Triphenylphosphin/Azodicarbonsaureester, 2-Pyridindisulfid/Triphenylphosphin, Carbonyldiimidazol etc.

10

Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Acylierungsreaktion in Gegenwart einer Base auszuführen. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein geringer Überschuß der Hilfsbase z.B. 1,2 bis 1,5 15 Molaquivalente, bezogen auf II, kann unter Umständen vorteilhaft sein.

Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin oder Alkalimetallcarbonate. Als Lösungsmittel können z.B. chlorierte 20 Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran,

Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder Ester wie Essigsäure-

25 ethylester oder Gemische hiervon verwendet werden.

Werden Benzoylhalogenide als aktivierte Carbonsäurekomponente eingesetzt, so kann es zweckmäßig sein, bei Zugabe dieses Reaktionspartners die Reaktionsmischung auf 0-10°C abzukühlen. Anschlie-30 Bend rührt man bei 20 - 100°C, vorzugsweise bei 25 - 50°C, bis die Umsetzung vollständig ist. Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher Weise, z.B. wird das Reaktionsgemisch auf Wasser gegossen, das Wertprodukt extrahiert. Als Lösungsmittel eignen sich hierfür besonders Methylenchlorid, Diethylether und Essigsäureethylester.

<del>35 Nach Trocknen der organischen Phase und Entfernen des Lösungs-</del> mittels kann der rohe Ester ohne weitere Reinigung zur Umlagerung eingesetzt werden.

Die Umlagerung der Ester zu den Verbindungen der Formel I erfolgt 40 zweckmäßigerweise bei Temperaturen von 20 bis 40°C in einem Lösungsmittel und in Gegenwart einer Base sowie gegebenenfalls mit Hilfe einer Cyanoverbindung als Katalysator.



960970

0.Z. 0050/47679 ···

101

Als Lösungsmittel können z.B. Acetonitril, Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Dioxan, Essigsäureethylester, Toluol oder Gemische hiervon verwendet werden. Bevorzugte Lösungsmittel sind Acetonitril und Dioxan.

Geeignete Basen sind tertiäre Amine wie Triethylamin, Pyridin oder Alkalicarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu einem vierfachen Überschuß, bezogen auf den Ester, eingesetzt werden. Bevorzugt 10 werden Triethylamin oder Alkalicarbonate verwendet, vorzugsweise in doppelt äquimolaren Verhältnis in Bezug auf den Ester.

Als Cyanoverbindungen kommen anorganische Cyanide, wie Natriumcyanid, Kaliumcyanid und organische Cyanoverbindungen, wie
15 Acetoncyanhydrin, Trimethylsilycyanid in Betracht. Sie werden in
einer Menge von 1 bis 50 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt. Vorzugsweise werden Acetoncyanhydrin oder Trimethylsilylcyanid, z.B. in einer Menge von 5 bis 15, vorzugsweise 10
Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt.

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise erfolgen. Das Reaktionsgemisch wird z.B. mit verdünnter Mineralsäure, wie 5 %ige Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert, mit einem organischen Lösungsmittel, z.B. Methylenchlorid, Essigsäureethylester

- 25 extrahiert. Der organische Extrakt kann mit 5-10%iger Alkalicarbonatlösung, z.B. Natriumcarbonat-, Kaliumcarbonatlösung extrahiert werden. Die wäßrige Phase wird angesäuert und der sich bildende Niederschlag abgesaugt und/oder mit Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert, getrocknet und eingeengt.
- 30 (Beispiele für die Darstellung von Estern von Hydroxypyrazolen und für die Umlagerung der Ester sind z.B. in EP-A 282 944 und US 4 643 757 genannt).

Verfahren B:

Umsetzung von 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivaten der Formel I (mit z=H) mit einer Verbindung der Formel V (mit  $z=SO_2R^{17}$ ):

I (mit Z = H)

20 L<sup>2</sup> steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie Halogen, z.B. Brom, Chlor, Hetaryl, z.B. Imidazolyl, Pyridyl, Sulfonat, z.B. OSO<sub>2</sub>R<sup>17</sup>.

Die Verbindungen der Formel V können direkt eingesetzt werden, 25 wie z.B. im Fall der Sulfonsäurehalogenide, Sulfonsäureanhydride oder in situ erzeugt werden, z.B. aktivierte Sulfonsäuren (mittels Sulfonsäure und Dicyclohexylcarbonyldiimid, Carbonyldiimidazol etc.).

- 30 Die Ausgangsverbindungen werden in der Regel im äquimolaren Verhältnis eingesetzt. Es kann aber auch von Vorteil sein, die eine oder andere Komponente im Überschuß einzusetzen.
- Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Umsetzung in Gegen35 wart einer Base durchzuführen. Die Reaktanden und die Hilfsbase
  werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt.
  Ein Überschuß der Hilfsbase z.B. 1,5 bis 3 Moläquivalente,
  bezogen auf II, kann unter Umständen vorteilhaft sein.
- 40 Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, wie Triethylamin, Pyridin, Alkalimetallcarbonate, z.B. Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Alkalimetallhydride, z.B. Natriumhydrid. Bevorzugt verwendet werden Triethylamin und Pyridin.
- 45 Als Lösungsmittel kommen z.B. chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether,



20

25

960970 O.Z. 0050/47 103

Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder Ester, wie Essigsäureethylester, oder Gemische hiervon in Betracht.

In der Regel liegt die Reaktionstemperatur im Bereich von 0°C bis zur Höhe des Siedepunktes des Reaktionsgemisches.

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise zum Produkt hin 10 erfolgen.

Die als Ausgangsmaterialien verwendeten Pyrazole der Formel II (mit Z = H) sind bekannt oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (z.B. EP-A 240 001 und J. Prakt. Chem. 15 315, 383 (1973)).

3-Heterocyclyl-substituierte Benzoesäurederivate der Formel III

sind neu,

$$\begin{array}{c|c}
0 & R^1 & N & X \\
R^2 & R^3 & R^2
\end{array}$$

III

wobei die Variablen folgende Bedeutung haben.

30 R1, R2 Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C1-C6-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C1-C6-Halogenalkylsulfinyl, C1-C6-Alkylsulfonyl oder C1-C6-Halogenalkylsulfonyl;

- R<sup>3</sup> Wasserstoff, Halogen oder C1-C6-Alkyl;
- R4, R5 Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C1-C4-Alkyl,  $C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl$ , Di- $(C_1-C_4-alkoxy)-C_1-C_4-alkyl$ , Di- $(C_1-C_4-alkyl)$ -amino- $C_1-C_4-alkyl$ ,  $[2,2-Di-(C_1-C_4-alkyl)-hydrazino-1]-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_6-Alkyl$ kyliminooxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl- $C_1-C_4$ -alkyl,  $C_1-C_4$ -Alkylthio- $C_1-C_4$ -alkyl,  $C_1-C_4$ -Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Cyanoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, 45  $C_1-C_4-Alkoxy-C_2-C_4-alkoxy$ ,  $C_1-C_4-Halogenalkoxy$ , C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Di-(C1-C4-alkyl)amino, COR6, Phenyl oder Benzyl, wobei

960970

O.Z. 0050/47679

104

die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C1-C4-Halogenalkoxy;

oder

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> bilden gemeinsam eine C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkandiyl-Kette, die einbis vierfach durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann
und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein
kann;

15 oder

R4 und R5 bilden gemeinsam mit dem zugehörigen Kohlenstoff eine Carbonyl- oder eine Thiocarbonylgruppe;

20  $R^6$   $C_1-C_4-Alkyl$ ,  $C_1-C_4-Halogenalkyl$ ,  $C_1-C_4-Alkoxy$ ,  $C_1-C_4-Alkoxy$ ,  $C_3-C_6-Alkoxy$ 

R<sup>7</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

25

 $R^8$   $C_1$ - $C_4$ -Alkyl;

X O, S, NR9, CO oder CR10R11;

30 Y O, S,  $NR^{12}$ , CO oder  $CR^{13}R^{14}$ ;

R9, R12 Wasserstoff oder C1-C4-Alkyl;

R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxycarbonyl oder

CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>;

oder,

45

40 R<sup>4</sup> und R<sup>9</sup> oder R<sup>4</sup> und R<sup>10</sup> oder R<sup>5</sup> und R<sup>12</sup> oder R<sup>5</sup> und R<sup>13</sup> bilden gemeinsam eine C<sub>2</sub>·C<sub>6</sub>-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C<sub>1</sub>·C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C<sub>1</sub>·C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

R19 Hydroxy oder abhydrolysierbarer Rest;

960970 O.Z. 0050/47679

105

mit Ausnahme von 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methyl-sulfonyl-benzoesäuremethylester und 2-Chlor-3-(4,5-dihydro-oxazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

- 5 Reispiele für abhydrolysierbare Reste sind Alkoxy-, Phenoxy-, Alkylthio-, Phenylthio-Reste, die gegebenenfalls substituiert sein können, Halogenide, Hetarylreste, die über Stickstoff gebunden sind, Amino, Imino-Reste, die gegebenenfalls substituiert sein können etc.
- Bevorzugt sind 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoesäurehalogenide der Formel III $\alpha'$ , mit  $L^{1'}$  = Halogen ( $\stackrel{\triangle}{=}$  III mit  $R^{19}$  = Halogen),



20

30

III**a**'

wobei die Variablen R<sup>1</sup> bis R<sup>5</sup>, X und Y die unter Formel III genannte Bedeutung haben und

25 L1' Halogen, insbesondere Chlor oder Brom bedeutet.

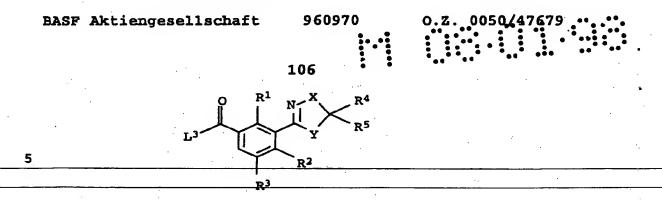
Ebenso bevorzugt sind 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoesäuren der Formel III $\beta$  ( $^{\triangle}$  III mit  $R^{19}$  = Hydroxy),



IIIB

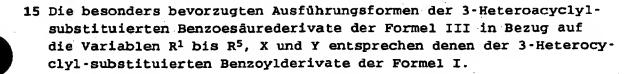
wobei die Variablen  $\mathbb{R}^1$  bis  $\mathbb{R}^5$ , X und Y die unter Formel III genaante Bedeutung haben.

Ebenso bevorzugt sind 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoesaureester der Formel III $\gamma$  (\text{\text{\text{\text{\text{\text{Benzoesaure}}}}}} = C\_1-C\_6-Alkoxy),

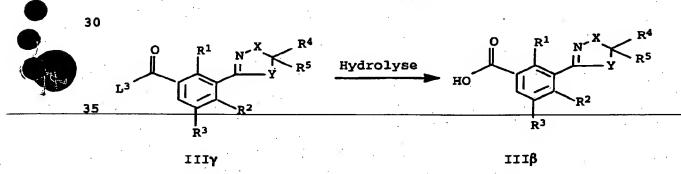


IIIY

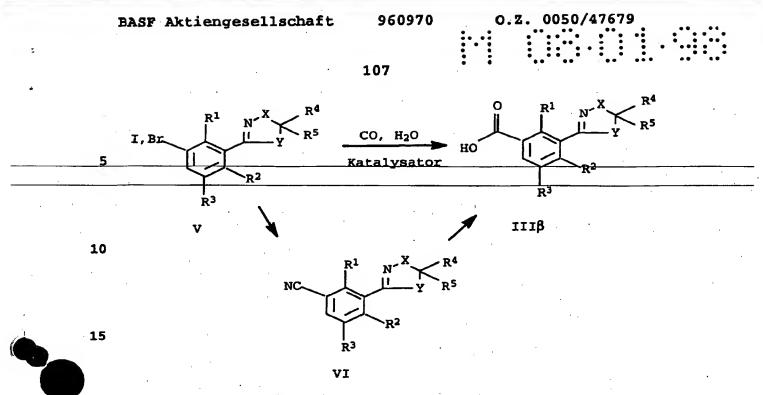
- 10 wobei die Variablen  $\mathbb{R}^1$  bis  $\mathbb{R}^5$ , X und Y die unter Formel III genannte Bedeutung haben und
  - $L^3$   $C_1 \cdot C_6 \cdot Alkoxy$  bedeutet.



- 20 Die Benzoylhalogenide der Formel IIIa' (mit  $L^{1'}$  = C1, Br,) können auf an sich bekannte Art und Weise durch Umsetzung der Benzoesäuren der Formel III $\beta$  mit Halogenierungsreagentien wie Thionylchlorid, Thionylbromid, Phosgen, Diphosgen, Triphosgen, Oxalylchlorid, Oxalylbromid hergestellt werden.
- Die Benzoesäuren der Formel III $\beta$  können in bekannter Weise durch saure oder basische Hydrolyse aus den entsprechenden Estern der Formel III $\gamma$  (L<sup>3</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy) hergestellt werden.



40 Ebenso können die Benzoesäuren der Formel IIIβ durch Umsetzung von entsprechenden Brom- oder Iod-substituierten Verbindungen der Formel V, in Gegenwart eines Palladium-, Nickel-, Cobalt- oder Rhodium-Übergangsmetallkatalysators und einer Base mit Kohlenmonoxid und Wasser unter erhöhtem Druck erhalten werden.



Weiterhin ist es möglich durch Rosenmund-von Braun-Reaktion

20 Verbindungen der Formel V in die entsprechenden Nitrile der Formel VI zu überführen (vgl. z.B. Org. Synth. Bd III, 212 (1955))

und diese durch nachfolgende Verseifung in die Verbindungen der
Formel IIIß umzuwandeln.

25 Die Ester der Formel IIIy können durch Umsetzung von Arylhalogen-

verbindungen oder Arylsulfonaten der Formel VII, wobei L<sup>4</sup> für eine Ausgangsgruppe wie Brom, Iod, Triflat, Fluorsulfonyloxy etc. steht, mit Heterocyclyl-Stannaten (Stille-Kupplungen), Heterocyclyl-Borverbindungen (Suzuki-Kupplungen) oder Heterocyclyl-Zink-30 verbindungen (Negishi-Reaktion) VIII, wobei M entsprechend für Sn(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl)<sub>3</sub>, B(OH)<sub>2</sub>, ZnHal (mit Hal = Chlor, Brom) etc. steht, auf an sich bekannte Art und Weise (vgl. z.B. Tetrahedron Lett. 27, 5269 (1986) in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-Übergangsmetallkatalysator und gegebenenfalls einer Base erhalten





OSO<sub>2</sub>F)

960970

O.Z. 0050/47679

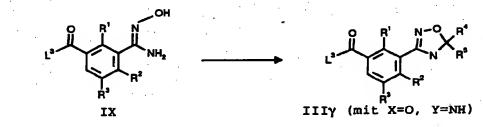
108

10 (mit  $L^4 = Br$ , J, OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>,

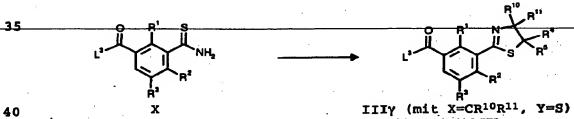
(mit M = Sn(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alky1)<sub>3</sub>,
 B(OH)<sub>2</sub>, ZnHal,
 wobei Hal für Cl
 oder Br steht)

15 Ebenso ist es möglich, Ester der Formel IIIy durch Aufbau des in 3-Position gebundenen Heterocycluses zu erhalten.

Beispielsweise können aus Amidoximen der Formel IX durch Kondensation mit Aldehyden oder Ketonen 1,2,4-Oxadiazolin-3-yl-Derivate 20 (III mit X=0, Y=NH) hergestellt werden (vgl. z.B. Arch. Phar. 326, 383-389 (1993)).

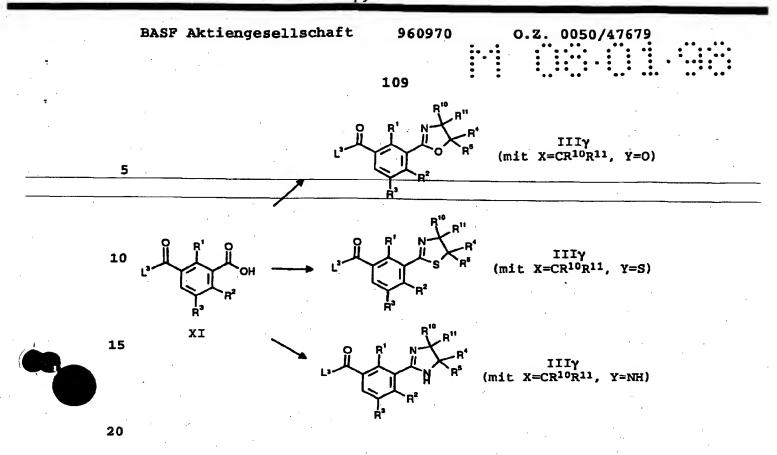


30 Die Thioamide der Formel X sind geeignete Vorprodukte für 2-Thiazolinyl-Derivate I (mit X=CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, Y=S) (vgl. z.B. Tetrahedron 42, 1449-1460 (1986)).



Aus den Carbonsäuren der Formel XI sind 2-Oxazolinyl-, 2-Thiazolinyl- und 2-Imidazolinyl-Derivate (IIIy mit X=CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, Y=O bzw. Y=S bzw. Y=NH) zugänglich (vgl. z.B. Tetrahedron Let. 22, 45 4471-4474 (1981)).





Nach literaturbekannten Verfahren können aus Carbonsäurehaloge25 niden der Formel XII, wobei Hal für Halogen steht, insbesondere aus Carbonsäurechloriden, 1,3-Thiazol-5(4H)-thion-2-yl- (vgl. z.B. Helv. Chim. Acta, 69, 374-388 (1986)) und 5-0xo-2-imidazolin-2-yl-Derivate (vgl. z.B. Heterocycles 29, 1185-1189 (1989)) (III mit X=CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, Y=S bzw. Y=NH) hergestellt werden.

30

R' N = S IIIY

(mit X=CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, Y=S)

R' N = S IIIY

R' (mit X=CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, Y=NH)

(mit\_X=CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, Y=NH)

Die Umwandlung von Oximen der Formel XIII in 4,5-Dihydro-isoxa-45 zol-3-yl-Derivate (mit IIIγ mit X=0, Y=CR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>) kann in an sich bekannter Weise über die Zwischenstufe der Hydroxamsäurechloride XIV erfolgen. Aus letzteren werden in situ Nitriloxide erzeugt,

960970

0.2. 0050/47679

110

die mit Alkenen zu den gewünschten Produkten abreagieren (vgl.
z.B. Chem. Ber. 106, 3258-3274 (1973)). 1,3-Dipolare Cycloadditionen von Chlorsulfonylisocyanat an Nitriloxide liefern
1,2,4-Oxadiazolin-5-on-3-yl-Derivate (IIIγ mit X=O, Y=NH) (vgl.
5 z.B. Heterocycles 27, 683-685 (1988)).

Die Aldehyde der Formel XIV können über die Zwischenstufe der Se20 micarbazone in 2,4-Dihydro-1,2,4-triazol-3-on-5-yl-Derivate (III
y mit X=NR<sup>9</sup>, X=NR<sup>12</sup>) umgewandelt werden (vgl.z.B. J. Heterocyclic Chem., 23, 881- 883 (1986)).

30

IIIY (mit  $X=NR^9$ ,  $Y=NR^{12}$ )

2-Imidazolinyl-Derivate (III $\gamma$  mit X=CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, Y=NH) sind auch aus Benzonitrilen der Formel XV nach bekannten Methoden (vgl.z.B. J. Org. Chem. 52, 1017-1021 (1987)) herzustellen.

Mittels 1,3 dipolarer Cycloaddition von Diazoalkanen bzw. Nitril-45 iminen mit Arylalkenen der Formel XVI können 3 Pyrazolinyl-Derivate (IIIy mit X=NH, Y=CHR<sup>13</sup>) dargestellt werden.

10

Die als Ausgangsverbindungen verwendeten Brom- oder Iod-substituierten Verbindungen der Formel V können in Analogie zu literaturbekannten Methode, z.B. durch Sandmeyer-Reaktion aus 15 entsprechenden Anilinen erhalten werden, die ihrerseits durch Reduktion geeigneter Nitroverbindungen synthetisiert werden. Die Brom-substituierten Verbindungen der Formel V können außerdem durch direkte Bromierung geeigneter Edukte erhalten werden (vgl. Monatsh. Chem. 99, 815-822 (1968)).

(mit X=NH, Y=CHR<sup>13</sup>)

Die Nitrile der Formel VI können wie oben beschrieben erhalten werden. Ebenso ist es möglich, diese aus entsprechenden Anilinen mittels Sandmeyer-Reaktion darzustellen.

25 Die Ausgangsverbindungen der Formel VII sind bekannt (vgl. z.B. Coll. Czech. Chem. Commun. 40, 3009-3019 (1975)) oder können leicht durch geeignete Kombination bekannter Synthesen hergestellt werden.



- 30 Beispielsweise können die Sulfonate XII (L<sup>4</sup> = OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OSO<sub>2</sub>F) aus den entsprechenden Phenolen, die ihrerseits bekannt sind (vgl. z.B. EP-A 195 247) oder nach bekannten Methoden hergestellt werden können, erhalten werden (vgl. z.B. Synthesis 1993, 735-762).
- 35 Die Halogenverbindungen VII (L4 = C1, Br oder I) können beispielsweise durch Sandmeyer-Reaktion aus entsprechenden Anilinen der Formel XIX erhalten werden.

Die Amidoxime der Formel IX, die Thioamide der Formel X und die 40 Carbonsäuren der Formel XI können auf an sich bekannte Art und - Weise aus den Nitrilen der Formel XV dargestellt werden.

Weiterhin ist es möglich, die Carbonsäuren der Formel XI aus den Aldehyden der Formel XIV nach bekannten Verfähren herzustellen 45 (vgl. z.B. J. March, Advanced Organic Chemistry, 3. Auflage, S. 629 ff, Wiley-Interscience Publication (1985)).

960970

O.Z. 0050/47679

112

Die Carbonsäurehalogenide der Formel XII können in Analogie zu Standardverfahren aus den entsprechenden Carbonsäuren der Formel XI erhalten werden.

- 5 Die Oxime der Formel XIII erhält man vorteilhaft dadurch, daß man in an sich bekannter Weise Aldehyde der Formel XIV mit Hydroxylamin umsetzt (vgl. z.B. J. March, Advanced Organic Chemistry, 3. Aufl., S. 805-806, Wiley-Interscience Publication (1985)).
- 10 Die Aldehyde der Formel XIV sind bekannt oder in Analogie zu bekannten Verfahren darstellbar. So können sie aus Methylverbindungen der Formel XVII durch Bromierung, beispielsweise mit N-Bromsuccinimid oder 1,3-Dibrom-5,5-dimethylhydantoin, und anschließende Oxidation dargestellt werden (vgl. Synth. Commun. 15 22, 1967 1971 (1992)).

Die Umwandlung der Oxime der Formel XIII in Nitrile der Formel XV kann ebenfalls nach an sich bekannten Verfahren erfolgen (vgl. z.B. J. March, Advanced Organic Chemistry, 3. Aufl., S. 931-932, 20 Wiley-Interscience Publication (1985)).

Ausgehend von den Halogenverbindungen oder Sulfonaten der Formel VII (L<sup>4</sup> = Br, Cl, OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OSO<sub>2</sub>F) lassen sich u.a. durch Heck-Reaktion mit Olefinen in Gegenwart eines Palladiumkatalysators

25 Arylalkene der Formel XVI darstellen (vgl. z.B. Heck, Palladium Reagents in Organic Synthesis, Academic Press, London 1985; Synthesis 1993, 735 - 762).



30

35

960970 ....0.z...0050/47679 .....

960970

O.Z. 0050/47679

114

Herstellungsbeispiele:

4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-ben-5 zoyl]-5-hydroxy-1-methyl-1H-pyrazol (Verbindung 3.35)

Zu einer Lösung von 12,74 g (0,13 mol) 5-Hydroxy-1-methyl-pyrazol und 300 ml wasserfreiem Dioxan wurden unter Schutzgasatmosphäre bei Raumtemperatur gleichzeitig 43,60 g (0,13 mol)

- 10 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl-chlorid in 375 ml wasserfreiem Dioxan und 13,56 g (0,134 mol)
  Triethylamin in 375 ml wasserfreiem Dioxan getropft. Nach 2 Stunden Rühren bei Raumtemperatur wurde das Reaktionsgemisch über
  Kieselgel abfiltriert und mit Dioxan nachgewaschen. Das Eluat
- 15 wurde am Vakuum auf ca. 500 ml eingeengt und mit 17,94 (0,13 mol) getrocknetem, fein gepulvertem Kaliumcarbonat versetzt. Nach 6 Stunden Erhitzen unter Rückfluß wurde das Lösungsmittel am Vakuum abdestilliert und der Rückstand in ca. 700 ml Wasser aufgenommen. Unlösliche Bestandteile wurden abfiltriert und der pH-Wert des
- 20 Filtrats durch langsame Zugabe von 10 %iger Salzsäure auf pH = 2 3 eingestellt. Der sich bildende Niederschlag wurde abgesaugt. Man erhielt 46,16 g (92 % d. Th.) 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-5-hydroxy-1-methyl-1H-pyrazol.
- 25 (Fp. > 250°C)

In Tabelle 3 sind neben der voranstehenden Verbindung noch weitere 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I aufgeführt, die in analoger Weise hergestellt wurden oder 30 herstellbar sind (falls die Endprodukte beim Ansäuern mit 10 %iger Salzsäure nicht ausgefallen sind, wurden sie mit Essigsäureethylester oder Dichlormethan extrahiert; anschließend wurde die organische Phase getrocknet und am Vakuum eingeengt):



35

40

	BASP	Aktiengesells	cha:	Et 9	609	70	0.z	0050/47679
				11	5			· · ·
*		,	*	<pre>ikalische baten . [°C]; [δ in ppm]</pre>	117	151	1,32 (m); ); ); d,61(t);	7,48(m).
		·		physikalische Daten Fp. [°C];	116	148	0,95(t); 1,62(t); 1,92(quin 3,30(t); 3,78(quar 4,17(t);	7,42(d);
		•		R18	H	H	<b>I</b>	
				2	Ħ	ж	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> SO <sub>2</sub>	
		X X X X X X X X X X X X X X X X X X X		R16	n-C4H9	1-C4H9	n-C4H9	
		~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~		¥	CH2	CH2	CH <sub>2</sub>	7
		0 = N	<b>.</b>	R5	H	н	ж	
		N N N N N N N N N N N N N N N N N N N		R4	H	ж	ш	
				×	0	0	0	
	•	•		R3	н	H	д	_
	·		- <del></del>	R2	12	ឫ	ਹ ====================================	
	 m	-		<u>r</u> z	링	5	5	
•	Tabelle			Nr.	3.1	3.2	m m	

	BA	SF A	.kt	:ie	ene	ge	se	:1:	lsc	:h	af	t			96	509	70	)	•.•	: (	<b>).</b> 2	3,.	00	50	/4	7-6	79:	•	:	•••		
														;	116	5				·		••	•	•		••		•	•			
	physikalische	aten [°C];	lo in ppm	1,21(d);				7,50(m).	1,20(d);	; 3,49 (m);	; 3,68(d);	_	; 7,49(d);		, 1,12(d);			7.48(d):		0 - 75	†	t	1		5 - 100	70 - 75	1	_				_
	ghyg	Pp.	-H-INMK	•	$\sim$	30	76,	7,42(d)	,97	•	•	4,12(t)	, 42	7,52(8)	0,97(t)	~	23 (	4,14(t)  7,42(d)	51	7	19	23	200	77	95	7						
	R18			Œ					H		_				H					E	ä		:   =		H	H	00					
	2			1-C4H9SO2					i-C4H9SO2		. •	_			C2H5SO2		-		*	H	H	:   #	5	:   :	Z;	C2H5SO2					Э	
	R16			1 -C4H9	,				n-C3H7						n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>		9			CH3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	ij	C. Hr.	67)	11-13n7	CH <sub>3</sub>					- · •	
	≯.			E					Œ,						CH2					CH2	GB,	Œ,	ij	1 2	7	E				•		
	RS		:	#								,			Ħ					皿	H	E	E	ä		=						
	R4			G				:	: ::						pri					COOC2H5	COOC2H5	සි	සි	Ę		CH3						
·	×		c	> . 		•		,	>		• .		•	.	0					0	0	0	0	0						.,		!
	<b>83</b>		þ	•				,	4					]:	z;					H	H	н	H	H	1							
	R <sup>2</sup>		13					5	•		•			[2]	3	*				SO2CH3	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	\$02CH3	SO2CH3	SO2CH3	10 Op	202cm3					٠	
	R1	- 1	ដ					ប	}					ε	;				- [	3	ច	<u>C</u> 1	ជ	ច	٤							
	Nr.		3.4					3.5	)			•		3.6	) )				;		3.8 8.8	3.9	3.10	3.11	3 12							



	BASF	Akt:	ien	ıge	sel	lsc	hai	Et		96	509	70		٥	. Z .	0	050	/4	76.7	9	•			
•										117	7 .								,					
	1× 10	TH-NWR [6 in ppm]	2 5	24 (2a); 1,53(t); 52(m); 3.05(dd);	(8); 3,52	(B); 7, 49 (C)	œ ·	96 (t); 1,53 (d); 68 (t);	(sext);	07 (dd);   3,32 (s); 58 (dd);	art);	15(t); 5.03(m); 46(d); 7,64(d);		╁			╁⊷	220 - 225	170 - 175					
	<u> </u>		╬	7 -		יי יי	4	) <u>,</u>	•	<u>m</u> m	ω, κ	4.0	4	-	+	  =		=						
	R18			<b>=</b>	.——		#	# 					=	- =	=	╀	Ë	-	-					
	2		1285302 2 C 11 CO	1-C4H95U2	. •		50	C2H55O2					Ħ	×	Ħ	Ħ	Ħ	æ	Ħ				•	
	R16		Cour	Czns			D 0 0	11-C3n7		-			CH3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	n-C3H7	n-C4H9	1-C4H9	CH3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>					
0	<b>&gt;</b>	į	į	7			Ę	7					ਲੁੰ	E	CH <sub>2</sub>	CH2	CH2	CH2	CH2					
	RS	=		:			Ħ	:					E	£	£	ਉਂ	E E	H	æ					
	R4	H.	ð	Î			CH;	]			9		CH3	CH3	CH3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C2H5	C2HS				•	
	×	0	0				0				•••••		0	0	0	0	0	0	0			. *		
	R <sup>3</sup>	Æ	E				H						Ħ	Ħ	H	H	H	Н	Ħ					_
	R <sup>2</sup>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO2CH3				SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			•			SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO2CH3	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	302CH3	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>					
·	<u>ت</u>	. ខ	ដ				ដ						ប	C	당	딩	당	ᇙ	ᄗ					
	Ŋ.	3.13	3.14				3.15					- · . <del></del>	3,16	3.17	3.18	_		_	3.22					

	BASF	Akti	len	ges	el:	lscha	£t	!	9609	970		0.2	Z	QQE	0/4	176 :	79.				
					-			1	18											•	
		1H-NMR [8 in ppm]	╁	58 - 63	+-	E : :	,74 (br); 1,91 ,53 (m); 3,26	,45(t); 3,76 ,18(t); 4,62	7,45(8); 7,64(d); 8,16(d).	0,96(d); 1,21(d); 2,33(m); 2,51(m);	(g); 3,44 (d); 3,99	4,61(t); 7,45(s); 7,66(d); 8,17(d).	97 (d); 1,66	3,36(m); 3,29(g);	(d); 4,60	7,47(s); 7,68(d); 8,18(d).					<del></del> .
	R18	=	: =	E	Ħ	Ħ				H			æ			•					
	27	×	:	H	C2H5SO2	i-C4H9SO2				i - C <sub>4</sub> H9 SO <sub>2</sub>			C2H5SO2		•	ò			• .	*	
	R16	n-C <sub>1</sub> H,	n-C4H9	1-C4H9	1-C4H9	n-C4H9				1-C4H9			i-C4H9		•						
	<b>&gt;</b>	g,	E.	GH2	E	СН2				CH2			CH2								. ]
	R5	æ	×	E		æ			一寸	<b>=</b>			Ħ								
8	R4	H	н	н	Н	<b>II</b>			*	Œ			<b>1</b> 23								i
	×	0	0	0	0	0			,	<b></b>			0					•			
	R3	ж	포	Ħ	H	æ			1	<b>=</b>			¤								_
-	R <sup>2</sup>	\$0 <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO2CH3	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		··	1500	20202	•t •:	G	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		·						
	R1	ដ	ដ	<b>ಪ</b>	ដ	<u>.</u>			5	3			ರ					•		÷	
	Nr.	3.23	3.24	3.25	3.26	3.4/			3 28				5. 28.								

960970	••••	0.2: 0050/47679	

						•								11	.9													_		
physikalische	Daten	ري ; دا :	in ppm]	, 29 (s);	3,78(q);				, 53 (m),	1,43(t);	, 91(8);	,48(s);	<u> </u>	_	117	218	250	128		- 1		7 (2) (2)		(40(8);	. (2)	00	223			
 瑞	B B		<u>ဇ</u>	- 64	-15-	-	_		12	<u>—</u>	~	7		- 1	un		12			Ľ			r (	- u	$\perp$		- 0			
phys		Pp.	TH - NMR	1,68(t)	(3,43(t)	3,92(8)	7,46(8)	(8, 17 (d)	1,23 (d)	3,28(s)	70	4,61(t)	1,00 (Q)		115	217		125	7.8	52	9 6	3 6		_	3		22			
R18				æ					Ħ			×	12	:	CH <sub>3</sub>	三	Œ	E	E	12	: 				=	:	н			
2				C2H5SO2					1-C4H9SO2				, a		<b>=</b>	ĸ	H	F	n-C,H,SO,	C.Heso.	700670				1	:	Н			
R16				CH3		-			CH <sub>3</sub>		-		n-C3H3	1	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Calle					CH3		CH <sub>3</sub>			
¥		•		Ğ,		_			CH2				Ë		CH2	CH <sub>2</sub>	CH2	E E	ਲ <b>਼</b>	ਲਿੰ	•				£		CH <sub>2</sub>			
R5		_		<b>#</b>					Ħ				Ħ		E	Œ	I	E	H	Ħ					£		Ħ			
R4				×					<b>=</b>		1		H	:	II.	Ħ	н	H	H	=					8		CH <sub>3</sub>			
×				o .					0				0	,	٥	0	0	0	0	0					0		0		•	٠.
R <sup>3</sup>			]:	<b>=</b>				1	<b>=</b>				Ħ	þ		н	н	н	н	Ħ					E		E			_
R2		\T'.	1000	302CH3					SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		•		ជ	3	3	NO <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	घ	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		×	12-5	<u> </u>	SO2C2H5		SO2C2H5			
<b>1</b> 2		-	٤	ქ ქ	• •	-		7;					ᇙ	Ξ	;	ಪ	12	5	บ	CJ					2	1	3			
Ņ.			2 20	00:5					3.31				3.32	3,33		3.34	3.35	3.36	3.37	3.38					3.39	,	3.40			



	BASF A	kti	.eng	esel:	lsch	naft		96	0970		•••	o.z	•••	005	9/4 : •	176	79	•		·	
				<del></del>		<del>-</del> -		120				·	•			<b></b>	•		,		
	physikalische Daten Fp. [PC];	2 6	,12(t);	1,76(quin); 3,18(dd); 3,38(t); 3,55(dd); 3,73(s);	(E)	-	3	78 (quin); 07 (dd); 3,	38,1	~ !	1.33(8): 3 40(8):	(a) (c)		133	> 230	170 - 175			 	<u> </u>	-
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	R18	p	H				H			Ħ	: 12		Ħ	Ħ	Ħ	Н					
	22	#	# ##				H	٠	· ·	×		Œ.	Na+	**	Lii*	NH4+					
	R16	C3Hc	CH3				C2H5			ŧ	CH <sub>3</sub>	•	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C2H5	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>				•	
	×	Ğ.	GH3				CH <sub>2</sub>	-		•	0		CH2	GH2	CH2	CH2		•			
	S.	×	H				H			=	E		E	×	æ	H					
	R4	CH <sub>3</sub>	CH3				СН3			H	н	,	Ħ	Œ	н	H					
	×	0	0				0			GB <sub>2</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0	0	0	0					
•	<u>چ</u>	Ħ	H				ı.			==	æ		н	Н	×	Ħ					
-	R2	SO2C2H5	SO2-n-C3H7		-		SO2-n-C3H7			302CH3	SO2CH3		SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	<u>.</u> .		,					
	R1	ប	ដ				<u>ರ</u>			ច្ប	[]		ᇙ	ฮ	당	<u></u>					
·	Nr.	3.41	3.42				3.43		·. ——	3.44	3.45	i	3.46	3.47	3.48	3.49					



	BASF	Akti	enç	jes	<b>e</b> 11	lschaft		96	509	70	··		).Z	••(	05	Q/4	76	79.	. :		:	
								12:	l					•	,		,	,				
	ka _	1H-NMR [6 in ppm]	206 - 214	12		,27(t); 1,36(s); ,41(q); 4,01(q); ,18(s); 7,47(s); ,83(d); 8,07(d).	99 - 104	95-100	230-235	190-195	95-100	× 230	198-200	215-218	213-215	186-190	84-86	·				
	R18		=	E	E	H H E 4-7	m	E	E	ш	二	=	H	E	H	H	Ħ					
	. 2	Na+	K	Li+	NH4+	н	H	æ	E	H	H	H	E	ж	H	H	н				,	
	R16	CH3	GB <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH3	C <sub>2</sub> H <sub>S</sub>	C2H5	CH3	GH3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	E	C2HS	СН3	C2H5	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>S</sub>		: .			
*	>-	E	83	GH2	CH2	0	-H2c	-HZ	CH2	CH2	CH2	CH <sub>2</sub>	CH2	CH2	CH2	CH2	CH <sub>2</sub>			•		
	<del>ر</del> چ	×	H	×	H	×	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH	- (сн <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> сн-	- 7	,	CH2) 2	GH3	CH3	н	н	Н	н		٠.			
	R4	H	H	н	Ħ	ж	H	н	- (CH <sub>2</sub> ) 4 -	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	СН3	· CH3	Н	н	н	Н					
	×	0	0	. 0	0	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0	0	0	0 .	0	0	0	0	0	0	0					
	R3	エ	Ħ	H	н	ж	н	н	Н	H	н	Н	н	н	H	Ħ	Ħ					
	R <sup>2</sup>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO2CH3	302CH3	<b>S</b> O <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	зо <sub>2</sub> сн <sub>3</sub>	30 <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	\$0 <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO2C2HS	SO2C2H5	SO2C2H5	SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	802-n-C3H7	SO2-n-C3H7					
•	R1	ដ	CJ	ឌ	ប	ฎ	ប	ជ	ប	ဌ_	<b>5</b>	ច	<u>ប</u> _	ជ	ប	ច [	디				•	
	Nr.	3.50	3.51	3.52	3.53	3.54 a)	3.55	3.56	3.57	3.58	3.59	3.60	3.61	3.62	3.63	3.64	3.65					:

			•															
	BASF A	kti	eng	ese	:11	schaf	t	960	97	0	0.	Z : • .(	1050	/47	79			
-								122		· .					•		•	•
		10 1n ppm10-0-95	75	55	148-153	l · e	3, U3 (8) ; 4, 39	(s); 8,09		Kallum.			· .					
	Date	2   6	70-75	50-55	8	1.2	· · ·	2 <del>2</del> 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2	$\dashv$	ren n		<del></del>						
	physi I Fp.	YWN - H-			1	1,25 (t (t); 1,	(s) ; 3, 4, 04 (d	6	(g) .	zwei Aquivalenten	7-		*	τ		,		·
	R18	æ	H	Ħ	H	Ħ												
	2	щ	=	H	C <sub>2</sub> H <sub>S</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>				entoylchlorid mit		*		•				
	R16	CH3	GH3	C2H5	СН3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		-		<pre>/lethylaminocarbonyl)-4-mathylsulfonyl-benzoylchlorid mit</pre>								
	>-	CH <sub>2</sub>	CH2	CH2	CH2	CH2		•	1	ony1)		•				,		
	R5	(2) 20 (CH <sub>2</sub> ) 2- (CH <sub>2</sub> ) (CH <sub></sub>	C <sub>2</sub> H <sub>S</sub> (	1	$\vdash$	- (CH <sub>2</sub> ) 4- (	<del></del>		1	aminocarbo	•							
•	R4	- (CH <sub>2</sub> ) 20 (	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C2H5	- (CH <sub>2</sub> ) 4 -	. (CB				imethylethyl	٠.	•						`. • a
	×	0	0	0	0	0				lor-2',2'-d	~ 							
	R3	111	н	H	н	H			7	ਰ :-								
	R <sup>2</sup>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO2CH3	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	30 <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	30 <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		* : <u>-1-=-</u> :		t aus 2-Chlor-3-(1'-chlor-2', 2'-dimethy	s villa		. <del></del> ;*		-			
	R1	ច	ᄗ	ឆ	ជ	ជ		•		natellt			<del></del> -					
		_		_														

3.66 3.67 3.68 3.69 3.70 BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679

Nachfolgend sind die Synthesen einiger Ausgangsstoffe aufgeführt:

2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl-5 chlorid (Verbindung 4.5)

#### Stufe a) 2-Chlor-3-methyl-4-methylthio-acetophenon

10

15

20

25

30

Zu einer Suspension von 286 g (2,14 mol) Aluminiumtrichlorid in 420 ml 1,2-Dichlorethan wurde bei 15-20°C
eine Lösung von 157 g (2 mol) Acetylchlorid in 420 mol
1,2-Dichlorethan getropft. Anschließend wurde eine Lösung
von 346 g (2 mol) 2-Chlor-6-methylthio-toluol in 1 l
1,2-Dichlorethan zugetropft. Nach 12 Stunden Rühren wurde
das Reaktionsgemisch in eine Mischung aus 3 l Eis und 1 l
konz. HCl gegossen. Es wurde mit Methylenchlorid extrahiert, die organische Phase mit Wasser gewaschen, mit
Natriumsulfat getrocknet und eingeengt. Der Rückstand
wurde im Vakuum destilliert. Man erhielt 256 g (60 %
d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methyl-thio-acetophenon.
(Fp.: 46°C)

Stufe b) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-acetophenon

163,0 g (0,76 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylthio-acetophenon wurden in 1,5 l Eisessig gelöst, mit 18,6 g
Natriumwolframat versetzt und unter Kühlung 173,3 g
30 %ige Wasserstoffperoxidlösung zugetropft. Es wurde
2 Tage nachgerührt und anschließend mit Wasser verdünnt.
Der ausgefallene Feststoff wurde abgesaugt, mit Wasser
gewaschen und getrocknet. Man erhielt 164,0 g (88 %
d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-acetophenon.
(Fp.: 110-111°C)

#### 35 Stufe c) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesaure

82 g (0,33 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-acetophenon wurden in 700 ml Dioxan gelöst und bei Raumtemperatur mit 1 l einer 12,5 %igen Natriumhypochloritlösung versetzt. Anschließend wurde 1 Stunde bei 80°C nachgerührt. Nach dem Abkühlen bildeten sich zwei Phasen, von denen die untere mit Wasser verdünnt und schwach angesäuert wurde. Der ausgefallene Feststoff wurde abgesaugt, mit Wasser nachgewaschen und getrocknet. Man erhielt 60 g (73 % d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure.

(Fp.: 230-231°C)

960970 BASF Aktiengesellschaft O.Z. 0050/47679 Stufe d) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester 100 g (0,4 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure wurden in 1 1 Methanol gelöst und bei Rückflußtemperatur 5 Stunden mit Chlorwasserstoff begast. 5 Anschließend wurde eingeengt. Man erhielt 88,5 g (84 % d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesauremethylester. (Fp.: 107-108°C) 10 Stufe e) 3-Brommethy1-2-chlor-4-methylsulfony1-benzoesäuremethyl-82 g (0,31 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester werden in 2 1 Tetrachlormethan gelöst 15 und unter Belichtung portionsweise mit 56 g (0,31 mol) N-Bromsuccinimid versetzt. Das Reaktionsgemisch wurde filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand in 200 ml Methyl-tert.-butylether aufgenommen. Die Lösung wurde mit Petrolether versetzt, der ausgefallene Fest-20 stoff abgesaugt und getrocknet. Man erhielt 74,5 g (70 % d.Th.) 3-Brommethy1-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesauremethylester. (Fp.: 74-75℃) 25 Stufe f) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesauremethylester Eine Lösung von 41,0 g (0,12 mol) 3-Brommethyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester in 250 ml Aceto-30 nitril wurde mit 42,1 g (0,36 mol) N-Methylmorpholin-N-oxid versetzt. Der Ansatz wurde 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, anschließend eingeengt und der Rückstand in Essigsäureethylester aufgenommen. Die Lösung wurde mit Wasser extrahiert, mit Natriumsulfat getrocknet und eingeengt. Man erhielt 31,2 g (94 % d.Th.) 2-Chlor-3-formy1-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Fp.: 98-105°C) Stufe g) 2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure 40 15,00 g (54 mmol) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 4,20 g (60 mmol) Hydroxylaminhydrochlorid wurden in 300 ml Methanol aufgenommen und eine Lösung von 3,18 g (30 mmol) Natriumcarbonat in 80 ml 45 Wasser zugetropft. Nach 12 Stunden Rühren bei Raumtemperatur wurde das Methanol abdestilliert, der Rückstand mit

Wasser verdünnt und mit Diethylether extrahiert. Nach

960970

0.2. 0050/47679

125

Trocknen der organischen Phase wurde das Lösungsmittel entfernt. Man erhielt 14,40 g (91 % d.Th.)
2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

5 (Fp.: 126-128°C).

Stufe h) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoesäuremethylester (Verbindung 4.3)

In eine Lösung von 158,0 g (0,54 mol) 2-Chlor-3-hydroxy-iminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 1 l Dichlormethan wurde bei 15-20°C 30 Minuten lang Ethylen eingeleitet. Nach Zugabe von 1,6 g Natriumacetat wurden 454 ml Natriumhydrochlorit-Lösung bei 10°C unter gleichzeitiger Ethylen-Einleitung zugetropft. Anschließend wurde für weitere 15 Minuten Ethylen bei 10°C eingeleitet. Nach 12 Stunden Rühren wurden die Phasen getrennt, die organische Phase mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingeengt. Man erhielt 156,5 g (90 % d.Th.) 2-Chlor-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.

(1H-NMR ( $\delta$  in ppm): 3,24 (s); 3,42 (t); 3,99 (s); 4,60 (t); 7,96 (d); 8,10 (d)).

25 Stufe i) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoesäure (Verbindung 4.4)

Zu einem Gemisch von 170,0 g (0,54 mol) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 1 l Methanol wurde bei 40-45°C langsam eine Lösung von 32,8 g Natriumhydroxid gelöst in 330 ml Methanol getropft. Die Suspension wurde 5 Stunden bei 50°C gerührt. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels nahm man den Rückstand in 1,5 l Wasser auf und extrahierte die wäßrige Phase dreimal mit Essigsäureethylester. Die

wäßrige Phase wurde mit Salzsäure angesäuert und dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden anschließend mit Wasser neutral gewaschen, getrocknet und eingeengt. Man erhielt 148,8 g (91 % d.Th.) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure.

(1H-NMR (8 in ppm): 3,26 (s); 3,45 (t); 4,63 (t); 8,15 (s); 8,53 (s, br)).

20

30

10

15

40

BASF Aktiengesellschaft 960970 0.2.0050/47679126 Stufe j) 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoylchlorid (Verbindung 4.5) Zu einer Lösung von 139,0 g 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesaure, 1 ml Dimethylformamid und 1 1 trockenem Toluol wurden bei 50°C 74,8 g (0,63 mol) Thionylchlorid in 50 ml trockenem Toluol getropft. Nach 6 Stunden Erhitzen auf 110°C wurde das Lösungsmittel abdestilliert. Man erhielt 2-Chlor-3-(4,5-10 dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoylchlorid in quantitativer Ausbeute. (1H-NMR (8 in ppm): 3,25 (s); 3,46 (t); 4,62 (t); 8,21 (dd)). 15 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoylchlorid (Verbindung 4.39) Stufe a) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Verbindung 4.25) 20 In eine Lösung von 15,0 g (52 mmol) 2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 200 ml Dichlormethan wurde bei Raumtemperatur 30 Minuten lang Propen eingeleitet. Nach Zugabe von 1,6 g Natrium-25 acetat wurden 42,8 ml Natriumhydrochlorit-Lösung bei Raumtemperatur unter gleichzeitiger Propen-Einleitung zugetropft. Anschließend wurde für weitere 15 Minuten Propen bei Raumtemperatur eingeleitet. Nach 3 Stunden Erhitzen unter Rückfluß wurde 12 Stunden bei Raumtemperatur 30 gerührt, nochmals 5 Stunden unter Rückfluß Propen eingeleitet und wiederum 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Nach Trennung der Phasen wurde die organische Phase mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingeengt. Man erhielt 15,5 g (89 % d.Th.) 2-Chlor-(5-methyl-4,5-dihy-35 droisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester. (Fp.: 130-135℃). Stufe b) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methyl-40 sulfonyl-benzoesäure (Verbindung 4.26) Zu einem Gemisch von 15,00 g (45 mmol) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesauremethylester und 200 ml Methanol wurde langsam eine 45 Lösung von 3,52 g (88 mmol) Natriumhydroxid gelöst in

100 ml Methanol getropft. Die Suspension wurde 48 Stunden

bei Raumtemperatur gerührt. Nach Abdestillieren des

BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679

127

Lösungsmittels nahm man den Rückstand in Wasser auf und wusch die wäßrige Phase dreimal mit Essigsäureethylester.

wusch die wäßrige Phase dreimal mit Essigsäureethylester. Die wäßrige Phase wurde mit Salzsäure angesäuert und dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden anschließend mit Wasser neutral gewaschen, getrocknet und eingeengt. Man erhielt 13,20 g (92 % d.Th.) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure. (Fp.: 173-178°C).

10

20

5

Stufe c) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methyl-sulfonyl-benzoylchlorid (Verbindung 4.39)



Zu einer Lösung von 13,0 g (41 mmol) 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoesäure, 1 ml Dimethylformamid und 250 ml trockenem Toluol wurden bei Raumtemperatur 5,7 g (51 mmol Thionylchlorid getropft. Anschließend wurde bis zur vollständigen Umsetzung unter Rückfluß erhitzt. Nach Abkühlen wurde das Lösungsmittel abdestilliert. Man erhielt 14,2 g 2-Chlor-3-(5-methyl-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylbenzoyl-chlorid in quantitativer Ausbeute.

2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methyl-25 sulfonyl-benzoylchlorid

Stufe a) 2-Chlor-3-hydroxycarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesauremethylester



Zu einer Lösung von 115,3 g (0,42 mol) 2-Chlor-3formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und
2000 ml Acetonitril wurden bei 5°C nacheinander 13,8 g
(0,11 mol) Natriumhydrogenphosphatmonohydrat in 170 ml
Wasser, 49,3 g (0,43 mol) 30 %ige Wasserstoffperoxidlösung und 66,2 g (0,59 mol) 80 %ige wäßrige Natrium-

chloritlösung gegeben. Die Reaktionslösung wurde anschließend 1 Stunde bei 5°C und 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Dann wurde mit 10 %iger Salzsäure auf pH = 1 eingestellt und 1500 m1 wäßrige 40 %ige Natriumhydrogensulfit-Lösung zugegeben. Nach 1 Stunde Rühren bei Raumtemperatur wurde die wäßrige-Phase dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Natriumhydrogensulfit-Lösung-gewaschen und getrocknet. Nach Abdestillation des Lösungsmittels erhielt man 102,0 g 2-Chlor-3-hydroxycarbonyl-4-methyl-sulfonyl-benzoesäuremethylester.

40

35

```
O.Z. 0050/47679
                                   960970
    BASF Aktiengesellschaft
                                 128
             (^{1}H-NMR) (\delta in ppm): 3,34 (s); 3,93 (s); 8,08 (s); 14,50
             (s, br.).)
   Stufe b) 2-Chlor-3-chlorcarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesaure-
 5
            methylester
            Zu einer Lösung von 6,0 g (0,021 mol) 2-Chlor-3-hydroxy-
            carbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und
            50 ml trockenem Toluol wurden 2 Tropfen Dimethylformamid
            und 11,9 g (0,1 mol) Thionylchlorid gegeben. Die Lösung
10
            wurde 4 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach Entfernen
            des Lösungsmittels am Vakuum erhielt man 6,2 g 2-Chlor-3-
            chlorcarbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.
            (^{1}H-NMR) (\delta in ppm): 3,21 (s); 4,02 (s); 8,02 (d); 8,07
15
            (d).)
   Stufe c) 2-Chlor-3-(1'-hydroxy-2',2'-dimethylethylaminocarbo-
            nyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester
            Zu einer Lösung von 4,54 g (50 mmol) 2,2-Dimethylethanol-
20
            amin in 40 ml Dichlormethan wurde bei 0-5°C eine Lösung
            von 7,80 g (25 mmol) 2-Chlor-3-chlorcarbony1-4-methylsul-
            fonyl-benzoesäuremethylester getropft. Nach 6 Stunden
            Rühren bei Raumtemperatur wurde die Reaktionslösung drei-
            mal mit Wasser extrahiert, getrocknet und eingeengt. Man
25
            erhielt 8,20 g (80 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1'-hydroxy-2',2'-
            dimethylethylaminocarbonyl) - 4-methylsulfonyl-benzoesäure-
            methylester.
            (Fp.: 70-72°C).
30
   Stufe d) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbo-
            nyl) - 4 - methylsulfonyl-benzoesäuremethylester
           Ein Gemisch aus 6,9 g (20 mmol) 2-Chlor-3-(1'-hydroxy-
35
            2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-ben-
            zoesauremethylester und 5 ml Thionylchlorid wurde 6 Stun-
           den bei Raumtemperatur gerührt. Die Lösung wurde mit
           50 ml Dichlormethan verdünnt und anschließend eingeengt.
           Der Rückstand wurde in 20 ml Dichlormethan gelöst. Durch
           Zugabe von Cyclohexan bildete sich ein kristalliner Nie-
40
           derschlag, der abgesaugt und getrocknet wurde. Man er-
           hielt 6,4 g (88 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dime-
           thylethylaminocarbonyl) - 4-methylsulfonyl-benzoesäureme-
           thylester.
45
```

BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679 129 Stufe e) 2-Chlor-3-(4',4'-dimethyl-4',5'-dihydroxazol-2-yl)-4methylsulfonyl-benzoesäure (Verbindung 4.38) Eine Lösung von 5,82 g (15 mmol) 2-Chlor-3-(1'-chlor-5 2',2'-dimethylethylaminocarbonyl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 0,81 g (20 mmol) Natriumhydroxid <del>in 80 ml Methanol rührte 8 Stunden bei Raumtemperatur.</del> Nach Abdestillieren des Lösungsmittels wurde der Rückstand in Wasser aufgenommen und dreimal mit Essigsäure-10 ethylester gewaschen. Die wäßrige Phase wird mit Salzsäure angesäuert und dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Nach dem Trocknen der organischen Phase entfernte man das Lösungsmittel am Vakuum. Man erhielt 3,10 g (56 % d.Th.) 2-Chlor-3-(4',4'-dimethyl-4',5'-15 dihydrooxazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure. (1H-NMR ( $\delta$  in ppm): 1,34 (s); 3,40 (s); 4,13 (s); 8,07 (s); 13,95 (s, br)). Stufe f) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbo-20 nyl) - 4-methylsulfonyl-benzoylchlorid Eine Lösung von 3,00 g (9 mmol) 2-Chlor-3-(4',4'-dimethyl-4',5'-dihydrooxazol-2-y1)-4-methylsulfonyl-benzoesaure, 1,43 g Thionylchlorid und 1 Tropfen Dimethylform-25 amid in 80 ml trockenem Toluol wurde 3 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wurde das Lösungsmittel am Vakuum abdestilliert. Man erhielt 3,43 g (86 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1'-chlor-2',2'-dimethylethylaminocarbonyl) - 4 - methylsulfonyl - benzoylchlorid. 30 2-Chlor-3-(1,3,4-oxathiazolin-2-on-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Verbindung 4.22) Stufe a) 3-Aminocarbonyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäureme-35 thylester In eine Lösung von 15,0 g (48 mmol) 2-Chlor-3-chlor-

carbonyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und
300 ml trockenem Dioxan wurde 2 Stunden lang Ammoniak geleitet. Der gebildete Niederschlag wurde abgesaugt und
das Filtrat eingeengt. Man erhielt: 15, 2=g-3-Aminocarbonyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester in

'quantitativer Ausbeute.

BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679

Stufe b) 2-Chlor-3-(1,3,4-oxathiazolin-2-on-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

Zu einer Lösung von 4,37 g (15 mmol) 3-Aminocarbonyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester in 150 ml trockenem Toluol wurden 9,80 g (75 mmol) Chlorcarbonyl-sulfenylchlorid getropft. Nach 48 Stunden Rühren unter Rückfluß wird das Lösungsmittel am Vakuum entfernt und der Rückstand am Kieselgel chromatographiert (Eluent: Essigsäureethylester/Cyclohexan = 1/1). Man erhielt 3,70 g (70 % d.Th.) 2-Chlor-3-(1,3,4-oxathiazolin-2-on-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.



In der nachfolgenden Tabelle 4 sind neben den voranstehend be-15 schriebenen Verbindungen weitere Benzoesäurederivate der Formel III aufgeführt, die in analoger Weise hergestellt wurden oder herstellbar sind.

20

5

10

25



30

35

	BAS	F Aktieng	esellsc	haft		960	970		0.2	00	50/4	7679			
•						131					. •	-	••	••	
·				Daten	Ę	58 (t);	02 (s, br);	99 (s); 10 (d);		62 (t);	f (b) 69				
			Ţ	ohvaikalische D		3,91 (s); 4,5 7,83 (d).	(t); 7,	(t); 3, (d); 8,	(t); 4, (s, br)	(t); 4,	4,16 (s); 7,6 13,8 (s, br)		,		
				anda	.H.	3,29 (t); 3 7,46 (d); 7	G.E.	(3); (t);	3,26 (s); 3 8,15 (s); 8	(8)	(g);		•		
		% % %		R19	8	OCH <sub>3</sub>	НО	оснэ	НО	เอ	но			*	Θ
	•	× × × × × ×		¥		CH2	CH2	CH2	CH2	CH2	0				
			ri III	RS	<del>  </del>	Ħ	Ħ	æ	æ	×	×				
•		R19 .		R4		æ	н	Ħ	Ħ	H	Ħ				*
				×	·	0	0	0	O	Ο.	C (CH3) 2		9		
				R3		H	Æ	æ	æ	Ħ	H.				
· ·			. <u> </u>	R2		ยี	<u>ម</u>	302CH3	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CJ		<b></b> -		i, n.
	4.			1 <sup>24</sup>	-	3	3	<u> </u>	<u>ដ</u>	ជ	덩	, <u></u> , <u></u> ,			
	Tabelle			Nr.			7	£.3	,	_	4.6		:		÷

	_			
	77-4-3	engese	-11-	-b-E-
HASE	AKTI	endesi		CHATE

960970:... 0.2. 0050/47679 .....

							13	2				
	g	(S); (d);	(s); (s, br).			(dd); (m);		(t); (d).	(t);	(s, br);	(quin); (t);	(quin) ; (s).
	Daten	2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2	25 8	2 9		90,		1.8	4,46	4,15	8 2 8	1,58 8,05
	physikalische D Fp. [°C]; 1H-NWR [6 in p	(s); 3 (s); 7	i	(t); 3,41 (m); (t); 7,95 (d);	137-14	17.20	6 (m) cs	- 6	; 4,00 (t);	(s); 3,35 (t); (t); 8,05 (s).	0,95 (t); 1,47 (s); 1, 3,12 (s); 3,31 (s); 3, 3,93 (s); 8,09 (dd).	; 1,47 (s); ; 3,42 (t);
. :	R <sup>19</sup>	осн3	HO	оснэ	용	осн3	HÖ	OCH <sub>3</sub>	HO	HO	осн3	HO
	Ā	CH2	CH2	CH2	CH2	CH2	CH3	0	0	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	CH2
	RS	មី	æ	Ħ	H	æ	æ	m	Ħ	H	eg.	ජි
	R	СН3	CH3	æ	Ħ	CH3	CH3	æ	Ħ	н	снэ	CH3
	×	o	0	0	0	0	0	CH2	CH2	0	0	0
	R3	H	Ħ	н	H	æ	×	H	н	н	Ħ	æ
	R2	SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	SO2C2H5	SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	SO2C2H5	SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	SO2C2H5	sо <sub>2</sub> сн <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3O2СН3	302÷n-C3H7   	302-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	- R -	១	ฮ์		ដ	ដ	2	2	<u>5</u>		년 9	<u>.</u>
	Nr.	4.7	4.8	4.9	4.10	4.11	4.12	4.13	4.14	4.15	4.16	4.117





960970: 0.z. 0050/47679 ....

133.

											•	13:	<b>5</b> .								
physikalische Daten Fp. [°C];	H-NMR (6 in ppm]	(t); 1,55 (quin); 3,	3,93 (s); 4,50 (t); 8,08 (dd).	148-150	(t); 1,49 (d); 1,5	2,94 (dd); 3,42 (m); 3,93 (s); 4.97 (m); 8.10 (dd)	(+): 1.39 (d): 1	(); 3,50 (m); 4,95	8,05 (8).	3,24 (s); 4,02 (s); 8,14 (dd).	118-121	141		130-135	173-178	; 3,18 (8); 3,27	(8); 7,97 (d);	1,48 (8); 3,15 (8); 3,34 (8);	(t): 1.72	,72	-
R19		ОСНЗ		Ю	оснз		Hö			OCH <sub>3</sub>	SCH	, [	5	OCH3	НО	оснэ	٦	HO	OCH,		-
<b>×</b>		CH2		CH2	CH2		CH2			0	Ę	1 3		CH2	CH <sub>2</sub>	CH2		E E	GH,	,	
R5		<b>=</b>	];	=	Ħ		Ħ				H	=		# .	н	ਲ ਲ	į	<del></del>	æ		
R4		<b>:</b> :	12	п	CH3		ජි			0=	COOC2H5	COOC,He	100	Carj	CH3	CH3	120	5	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		
×	c	>	c	,	0		0			S	0	0	c	,	0	0	c		0		
<b>83</b>	12	:	Ē	1	Ľ	·	Н		1	=	н	H	=		=	ı.	E	;	×		1
R2	803-n-C3H-	/C)	802-n-C1H2	30.50	202   11   2347	-	SO2-n-C3H7	-	15 00	302CH3	3O <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO,CH,	1.50	302cm3	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO,CH,		SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	<i></i>	
<u>x</u>	2		ខ	Ε			ប		Ξ		3	ជ	[]	٤	3 8	3	៊ូ		.S.		]
Nr.	4.18		4.19	4.20			4.21		4 23		4.23	4.24	4.25	4 26		3	4.28		4.29		ļ





BASF	Akt	ien	aes	ell	schaf	t

960970... 0.2. 0050/47679 .....

						13	_					
	physikalische Daten Fp. [cc];		(m); 2,01 (m); 3,27 (c); 5,23 (dd); 8,05 (d); 13,8 (s, br).	(m); 3,23 (s); (m); 4,00 (s); (d).	78-83	1,78 (m); 2,24 (m); 3,27 (s); 3,36 (s); 3,98 (s); 7,94 (d);	8,12 (d).	1,76 (m); 2,05 (m); 3,30 (s); 3,33 (s); 8,09 (dd).	1,00 (t); 1,85 (m); 3,13 (s); 3,27 (s); 3,98 (s); 7,94 (d); 8,11 (d).	0,91 (t); 1,76 (m); 3,12 (s); 3,33 (s); 8,07 (dd); 13,75 (s, br).	1,34 (8); 3,40 (8); 4,13 (8); 8,07 (8); 13,95 (8, br).	
	<b>8</b> 18	OCH <sub>3</sub> 1	ОН 1	OCH <sub>3</sub>	Fo	OCH <sub>3</sub>	<u></u>	ОН	OCH <sub>3</sub>	8	НО	C1
	<b>→</b>	- (CH <sub>2</sub> ) 3-CH·	- (CH <sub>2</sub> ) 3-CH-	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	CH2		CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>	0	CH2
94	£	- (CH <sub>2</sub> )	- (CH <sub>2</sub> )	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	,		4-	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	н	Н
94	ž.	н	æ	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -0- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ·0- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	- (CH <sub>2</sub> ) 4-		- (CH <sub>2</sub> ) 4-	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<b>#</b>	СН3
,	∢	0	0	0	0	0		0	0	0	С (СН3) 2	Ó
53	4	æ	×	ж	н	æ		<b>=</b>	Æ	æ	Н	н
p2	4	зодсиз	802СН3	зо <sup>2</sup> сн <sup>3</sup>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	- <del>-</del> -	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	\$02CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	302CH3
12	1	<b>ជ</b>	บี	ដ	CI	ដ		<u></u>	ជ	ជ	ប្	ច
Nr.		4.30	4.31	4.32	4.33	4.34		4.35	4.36	4.37	4.38	4.39





960970 O.Z. 0050/47679

135

Die 3-Heterocycly-substituierten Benzoylderivate der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als 5 Herbizide. Die Verbindungen der Formel I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser 10 Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen der Formel I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung 15 unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris

- 20 spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoinensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis
- 25 guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot
- 30 esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa , Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum

35 tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera und Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen der Formel I auch in Kul-40 turen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden

gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Die Verbindungen der Formel I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt 45 versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, Öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln,





960970

O.Z. 0050/47679

36



13

Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der 5 erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die herbiziden Mittel enthalten eine herbizid wirksame Menge mindestens einer Verbindung der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I und für die Formulierung von Pflan-10 zenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.

Als inerte Hilfsstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht:
Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie
Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen
15 oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffine, Tetrahydronaphthalin,
alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole und
deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol
und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungs20 mittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können d

- 25 Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell
- 30 Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe (Adjuvantien) kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B.

- 35 Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutylnaphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner
- 40 Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylen-
- 45 oxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat,



960970 O.Z. 0050/47679

137

Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder 5 gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen <del>Trägerstoff hergestellt werden.</del>

Granulate, z.B. Umhūllungs-, Imprāgnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe her-10 gestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, 15 Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Konzentrationen der Verbindungen der Formel I in den 20 anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Im allgemeinen enthalten die Formulierungen etwa von 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spek-25 trum) eingesetzt.

Die folgenden Formulierungsbeispiele verdeutlichen die Herstellung solcher Zubereitungen:

20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 3.2 werden in einer 30 I. Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid,

> 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusol besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des

Wirkstoffs enthalt.

- II. - 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 3.9 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30-Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusol besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichts-

35

0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

BASF Aktiengesellschaft

960970

o.z. 0050/47679

138 teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die

20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.10 werden in einer TTT. Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 5 65 Gewichtstellen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige 10 Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.



20

25

IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.16 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalinsulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

- v. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.21 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 3.22 werden mit VI. 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkoholpolyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.



1 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 3.34 wird in einer 35 VII. Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

40

45

VIII. 1 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 3.35 wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol®-EM-31--(=-nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusol) besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

960970

O.Z. 0050/47679

139

Die Applikation der Verbindungen der Formel I bzw. der herbiziden Mittel kann im Vorauflauf- oder im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so konnen Ausbringungstechniken angewandt werden, bei wel-5 chen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, das die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen <del>nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe</del> auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

10 Die Aufwandmengen an Verbindung der Formel I betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz

15

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt 20 und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsaure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryloxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoesäure und deren Derivate, Benzothiadiazinone, 2-(Hetaroyl/Aroyl)-1,3-

- 25 cyclohexandione, Heteroaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CP3-Phenylderivate, Carbamate, Chinolincarbonsaure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexenonoximetherderivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole,
- 30 Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenylessigsäure und deren Derivate, 2-Phenylpropionsäure und 35 deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincar
  - bonsaure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide und Uracile in Betracht.
- 40 Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen der Formel I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner 45 die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von



960970

O.Z. 0050/47679

140

Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Anwendungsbeispiele

5

Die herbizide Wirkung der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivate der Formel I ließ sich durch die folgenden Gewächshausversuche zeigen:

10 Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.



Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder 15 emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Test-20 pflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt

0 pflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm 25 angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt.

30 Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 31,2 bzw. 15,6 g/ha a.S. (aktive Substanz).

Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 bis 25°C bzw. 20 bis 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte 35 sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 40 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich 45 aus folgenden Arten zusammen:

BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679

Lateinischer Name	Deutscher Name	Englischer Name
Chenopodium album	Weißer Gänsefuß	lambsquarters (goosefoot)
Setaria faberii	Borstenhirse	giant foxtail
Sinapsis alba	weißer Senf	white mustard
Solanum nigrum	Schwarzer Nachtschatten	black nightshade
Triticum aestivum	Winterweizen	winter wheat
Zea mays	Mais	Indian corn

Bei Aufwandmengen von 31,2 bzw. 15,6 g/ha zeigte die Verbindung 3.33 (Tabelle 3) im Nachauflauf eine sehr gute Wirkung gegen die oben genannten mono- und dicotylen Schadpflanzen und gute Verträglichkeit in Winterweizen und Mais.



960970 O.Z. 0050/47679

#### Patentansprüche

1. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I

5

 $\begin{array}{c|c}
0 & R^1 & N & X \\
R^1 & N & X \\
R^5 & R^5
\end{array}$   $\begin{array}{c|c}
R^2 & R^4 \\
R^5 & R^5
\end{array}$ 

6

in der die Variablen folgende Bedeutungen haben:

R1, R2 Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C1-C6-Alkyl,
C1-C6-Halogenalkyl, C1-C6-Alkoxy, C1-C6-Halogenalkoxy,
C1-C6-Alkylthio, C1-C6-Halogenalkylthio, C1-C6-Alkylsulfinyl, C1-C6-Halogenalkylsulfinyl, C1-C6-Alkylsulfonyl oder C1-C6-Halogenalkylsulfonyl;

R3 Wasserstoff, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl;

25 R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>

Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, [2,2-Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-hydrazino-1]-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyliminooxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cyclo-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogen-

alkylthio, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino, COR<sup>6</sup>, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

40

30

oder

45 970/96 He/kh 17.01.1997

	BASF Aktieng	esellschaft 960970 O.Z. 0050/47679	
	R <sup>4</sup> und R <sup>5</sup>	bilden gemeinsam eine $C_2$ - $C_6$ -Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch $C_1$ - $C_4$ -Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls $C_1$ - $C_4$ -Alkyl substituierten Stickstoff	
5_	<u> </u>	unterbrochen sein kann;	•
	oder		
	R4 und R5	bilden gemeinsam mit dem zugehörigen Kohlenstoff	
10	•	eine Carbonyl - oder eine Thiocarbonylgruppe;	
	R <sup>6</sup>	$C_1 \cdot C_4 \cdot Alkyl$ , $C_1 \cdot C_4 \cdot Halogenalkyl$ , $C_1 \cdot C_4 \cdot Alkoxy$ ,	
		$C_1 \cdot C_4 \cdot Alkoxy \cdot C_2 \cdot C_4 \cdot alkoxy$ , $C_1 \cdot C_4 \cdot Halogenalkoxy$ ,	
	,	C <sub>3</sub> ·C <sub>6</sub> ·Alkenyloxy, C <sub>3</sub> ·C <sub>6</sub> ·Alkinyloxy oder NR <sup>7</sup> R <sup>8</sup> ;	
15		of the Alkenylong, of the Alkinylong oder in it	
	. R <sup>7</sup>	Wasserstoff oder C1-C4-Alkyl;	
	R <sup>8</sup>	C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl;	
20	x	O, S, NR <sup>9</sup> , CO oder CR <sup>10</sup> R <sup>11</sup> ;	
	Y	O, S, NR <sup>12</sup> , CO oder CR <sup>13</sup> R <sup>14</sup> ;	
25	R <sup>9</sup> , R <sup>12</sup>	Wasserstoff oder C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl;	
	R10, R11,	R <sup>13</sup> , R <sup>14</sup> Wasserstoff, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogen-alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkoxycarbonyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkoxy-	
		carbonyl oder CONR <sup>7</sup> R <sup>8</sup> ;	
30	oder		
	R <sup>4</sup> und R <sup>9</sup>	oder R4 und R10 oder R5 und R12 oder R5 und R13 bil-	
		den gemeinsam eine C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> -Alkandiyl-Kette, die ein-	
		bis vierfach durch C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl substituiert sein	
35		kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebe-	
	•	nenfalls C1-C4-Alkyl substituierten Stickstoff un-	
		terbrochen sein kann;	
	R15	ein in 4-Stellung verknüpftes Pyrazol der For-	
40		mel II	:
	•		

	•	BASF	Aktienge	sellscha	ft	960970	0.3	z. 0050/	47679	•
						:-				•
				•		:				
•						3				
				R18						Ē
				11	<b>∏</b> ⁴					
				N_N	<u>''</u>		•	II .		
	_			1	O I					
	5	·		R1						
			·	·	Z	·		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		<del></del>
		•		wobei		•			8	
				MODET			•			
	10		1	R16	CooCoo	1 level -				
	10			K	C1-C6-A	TKAT!				
				Z	T odor	SO <sub>2</sub> R <sup>17</sup> ;				•
				4	u odei	202K }				•
		•		R <sup>17</sup>	C1 - C1 - A	1ky1, C <sub>1</sub> -0	CValog	analkyl	Phenyl	•
<b></b>	15		1				-		llständig	
			/						s drei der	
	١.	•		• •		len Gruppe			p dier der	
	,					Cyano, C <sub>1</sub>			Halogen-	
				101		$C_1 \cdot C_4 \cdot A1k$			and the second s	
	20			•	alkoxy;		ony outl	CI OF MG	Logen	
					arnon,				• .	
	•	•		R18	Wassers	toff oder	C1 -C4-A	1kv1		
•							1 -0			
	٠	•		bedeuten;	•					
•	25								,	•
		wo	obei X und	Y nicht	gleich:	zeitig für	r Sauers	toff oder	Schwefel	•
		st	tehen;						•	•
							•		•	
		ur	nd			•				
	30							•		
	•	im	lt Ausnahm	e von 4·[	2-Chlor	-3-(4,5-d	lihydrois	soxazo1-3	-y1)-	
1			methylsul:	_	_	_				
			[2-Chlor-					ethylsulf	onyl-ben-	•
			y1]-1,3-d	_	_					•
<u>-</u>	_35		[2-Chlor-						thyl-sul-	
			nyl-benzo							
			[2-Chlor-			_		ylsulfon	yl-ben-	
			y1]-1,3-d:		_					
			[2-Chlor-3					hylsulfo	nyl-ben-	
	40	20	yl]-1,3-di	lmethyl·5	-hydrox	y-1H-pyra	zol;	==		
		so	wie deren	landwirt	schaft1	ich brauc	hbaren S	alze.		•
	^		••••							
	2 4 E		Heterocycl			_			mel I	•
	45	na	ch Anspruc	n 1, wob	ei R³ Wa	asserstof	<u> bedeut</u>	et.		

		BASI	Aktienge	esellschaft	960970	O.Z. 0050/47679	••
f .							
<b>.</b>		3.	_	clyl-substituie unsprüchen 1 ode		ivate der Formel I	
	5		R1, R2	Nitro, Halogen alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Al		Alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Halogen- logenalkoxy,	
<del></del>				C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkylthic			
		·		C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alyklsuli C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Alkylsuli	inyl, C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> -Ha	logenalkylsulfinyl, 6-Halogenalkyl-	•
	10		bedeuten.	sulfonyl;			
						*	
				clyl substituie nsprüchen 1 bis		ivate der Formel I $r SO_2R^{17}$ steht.	
4	15	5.				ivate der Formel I r Wasserstoff steht.	
	20		nach den A	clyl-substituie nsprüchen 1 bis CR <sup>13</sup> R <sup>14</sup> stehen.	rte Benzoylder 3 oder 5, wob	ivate der Formel I ei X für Sauerstoff	
				clyl-substituie nsprüchen 1 bis		ivate der Formel I 6, wobei	
	25				•		
			R4		, C1-C4-Alkoxyo	C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alk- carbonyl-C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -alkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Halogenalkyl,	
1	30			C1-C4-Cyanoalky	l,, C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> -Cyclo -C <sub>4</sub> -alkoxy, C <sub>1</sub> -	oalkyl, C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkoxy, C <sub>4</sub> -Halogenalkoxy,	
		. •	*	wobei die beide	n letztgenannt	Phenyl oder Benzyl, en Substituenten par- niert sein können	·
· ·	35		,			lgenden Gruppen tra-	<u>.</u>
		•		Nitro, Cyano, C C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkoxy od		·C <sub>4</sub> -Halogenalkyl, nalkoxy;	
	40	. 1	<b>₹</b> 5	Wasserstoff ode	r C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> -Alkyl;		
	-		oder				
	45	I		ein- bis vierfa	ch durch C1 · C4	lkandiyl-Kette, die -Alkyl substituiert rstoff oder einen ge-	

BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679 gebenenfalls C1-C4-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann; oder 5 R<sup>5</sup> und R<sup>13</sup> bilden gemeinsam eine C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C1-C4-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C1-C4-Alkyl substituierten Stickstoff 10 unterbrochen sein kann; bedeuten. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I 15 nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5 bis 7, wobei  $C_1 - C_4 - Alkyl$ ,  $C_1 - C_4 - Halogenalkyl$ ,  $C_1 - C_4 - Alkoxy$ carbonyl oder CONR7R8; 20 R5 Wasserstoff oder C1-C4-Alkyl; oder R4 und R5 bilden gemeinsam eine C2-C6-Alkandiyl-Kette, die 25 ein· bis vierfach durch C1·C4·Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C1-C4-Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann; 30 oder  $R^5$  und  $R^{13}$  bilden gemeinsam eine  $C_2 \cdot C_6 \cdot Alkandiyl \cdot Kette, die$ ein- bis vierfach durch C1-C4-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C1-C4-Alkyl substituierten Stickstoff

#### bedeuten.

- 40 9. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5 oder 6, wobei R4 und R5 für Wasserstoff stehen.
- 10. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I

  45 nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5 oder 6 oder 9, wobei R<sup>18</sup>
  für Wasserstoff steht.

unterbrochen sein kann;

BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679

- 11. 4-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-ben-zoyl]-1-methyl-5-hydroxy-1H-pyrazol.
- 12. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I

  nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5, wobei

X S, NR9, CO oder CR10R11;

oder

10

Y O, S, NR12 oder CO;

bedeuten.



- 15 13. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5 oder 12, wobei R<sup>18</sup> für Wasserstoff steht.
- 14. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoylderivate der Formel I
  20 nach den Ansprüchen 1 bis 3 oder 5 oder 12, wobei

Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alk-oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Cyanoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino, COR<sup>6</sup>, Phenyl oder Benzyl, wobei die beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

30

25

Wasserstoff oder C1-C4-Alkyl;

oder

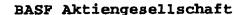
R5

R4

40 R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> bilden gemeinsam eine C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkandiyl-Kette, die ein- bis vierfach durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten-Stickstoff unterbrochen sein kann;

45

oder



960970 O.Z. 0050/47679

R4 und R9 oder R4 und R10 oder R5 und R12 oder R5 und R13 bilden gemeinsam eine C2·C6·Alkandiyl·Kette, die einbis vierfach durch C1·C4·Alkyl substituiert sein kann und/oder durch Sauerstoff oder einen gegebenenfalls C1·C4·Alkyl substituierten Stickstoff unterbrochen sein kann;

R18

C1-C6-Alkyl;

10 bedeuten.

15. Verfahren zur Herstellung von 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivaten der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man das Pyrazol der Formel II mit Z = H, wobei die Variablen R<sup>16</sup> und R<sup>18</sup> die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben,



20

15

5

$$N \sim N$$
OH
$$R^{16}$$
OH
II (mit Z = H)

25 mit einer aktivierten Carbonsäure IIIα oder mit einer Carbonsäure IIIβ,



30

$$L^{1} \xrightarrow{O} \begin{array}{c} R^{1} & N & X \\ & & & \\ & & & \\ R^{2} \end{array}$$

-35

<del>IIIa</del>

IIIB

wobei die Variablen R<sup>1</sup> bis R<sup>5</sup>, X und Y die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L<sup>1</sup> für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, acyliert und das Acylierungsprodukt, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, zu den Verbindungen I (mit Z = H) umlagert und gewünschtenfalls zur Herstellung von 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivaten der Formel I mit Z = SO<sub>2</sub>R<sup>17</sup> mit einer Verbindung der Formel V,

 $L^2 - SO_2 R^{17}$ 

wobei R17 die unter Anspruch 1 genannte Bedeutung hat und L2 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, umsetzt.

16. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoesäurederivate der Formel III,

10

$$\begin{array}{c|c}
0 & R^1 & N & X \\
R^1 & N & X \\
R^2 & R^5
\end{array}$$

III

20

25

30

15

wobei R19 für Hydroxy oder einen abhydrolysierbaren Rest steht und die Variablen R1 bis R5, X und Y die unter den Ansprüchen 1 bis 14 genannte Bedeutung haben, mit Ausnahme von 2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesauremethylester und 2-Chlor-3-(4,5-dihydrooxazol-2-yl)-4-methylsulfonylbenzoesäuremethylester.

17. 3-Heterocyclyl-substituierte Benzoesäurederivate der Formel III nach Anspruch 16, wobei

Halogen, Hydroxy oder C1-C6-Alkoxy R19

bedeutet.

35 18. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivats der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 14, und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.

and the state of t Verfahren zur Herstellung von Mitteln gemäß Anspruch 18, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-Heterocyclyl-substituierten\_Benzoylderivats der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1-bis-14-und-für-die Formu-45 lierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel mischt. BASF Aktiengesellschaft 960970 O.Z. 0050/47679

20. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderivats der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 14, auf Pflanzen, deren Lebensraum und/oder auf Samen einwirken läßt.

21. Verwendung der 3-Heterocyclyl-substituierten Benzoylderviate der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze gemäß den Ansprüchen 1 bis 14 als Herbizide.





# This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

### **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

BLACK BORDERS

IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES

FADED TEXT OR DRAWING

BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING

SKEWED/SLANTED IMAGES

COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS

GRAY SCALE DOCUMENTS

LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT

REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY

## IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

□ OTHER:

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.